CNF 1
2010

Chinese National Formulary

Chemicals and Biological Products

中国国家处方集

化学药品与生物制品卷

《中国国家处方集》编委会

人民军医出版社
PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

中国国家处方集
化学药品与生物制品卷
2010
人民军医出版社

Chinese National Formulary

Chemicals and Biological Products

中国国家处方集

化学药品与生物制品卷

策划编辑 李义祥 郝 涛
高玉婷 孙丰年
封面设计 吴朝洪
销售分类 临床医学/药物学

ISBN 978-7-5091-3056-8
9 787509 130568 >
定价：120.00元

CNF 1
2010

Chinese National Formulary

Chemicals and Biological Products

中国国家处方集

化学药品与生物制品卷

《中国国家处方集》编委会

人民軍醫出版社
PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS
北 京

图书在版编目（CIP）数据

中国国家处方集．化学药品与生物制品卷/《中国国家处方集》编委会编写．—北京：人民军医出版社，2010.1

ISBN 978-7-5091-3056-8

Ⅰ．①中…　Ⅱ．①中…　Ⅲ．①处方—汇编—中国②化学药剂—处方—汇编—中国③生物制品：药物—处方—汇编—中国　Ⅳ．①R451

中国版本图书馆 CIP 数据核字（2009）第 217973 号

策划编辑：李义祥　郝　涛　高玉婷　孙丰年　**文字编辑**：黄维佳　韩　志等

责任审读：黄栩兵　周晓洲　刘　平

出 版 人：齐学进

出版发行：人民军医出版社　　**经　销**：新华书店

通信地址：北京市 100036 信箱 188 分箱　　**邮　编**：100036

质量反馈电话：（010）51927290；（010）51927283

邮购电话：（010）51927252

策划编辑电话：（010）51927300—8056/8020

网址：www.pmmp.com.cn

印、装：北京华联印刷有限公司

开本：850 mm × 1168 mm　1/32

印张：33　**字数**：1783 千字

版、印次：2010 年 1 月第 1 版第 1 次印刷

印数：00001～10000

定价：120.00 元

王　庚　王　莹　王　强　王　睿　王　燕　王山米
王千秋　王子平　王宁利　王传跃　王汝龙　王良岸
王拥军　王育琴　王宝玺　王建六　王建业　王晓华
王海燕　王家伟　王满宜　韦军民　支玉香　毛节明
毛佩贤　尹　佳　孔旭东　石远凯　卢　丹　叶　华
叶铁虎　史亦丽　史丽敏　达万明　吕　强　吕富静
吕愈敏　朱　珠　朱元民　朱文玲　朱明炜　朱积川
乔　杰　华　琦　刘又宁　刘玉兰　齐晓涟　江泽飞
汤致强　孙宁玲　孙兴怀　孙忠实　孙春华　孙路路
孙颖浩　阴赪宏　李　明　李　鹏　李　静　李小平
李玉珍　李兴旺　李若瑜　李恒进　李泰生　李晓东
李晓青　李海潮　李嘉静　李继梅　李蓉生　李静然
杨　勇　杨　蓓　杨云生　杨文英　杨冬梓　杨春花
杨春秀　肖英莲　吴令英　吴学思　何焱玲　冷晓梅
辛钟成　汪　科　汪　复　沈　素　沈　敏　沈　琳
张　力　张　倩　张　烜　张　静　张玉海　张石革
张建中　张艳华　张晓乐　张爱琴　张祥华　张福成
张黎明　张澍田　张耀朋　陈　华　陈天凤　陈旻湖
陈香美　陈祖基　陈晓翔　陈海波　陈惠德　陈鄢津
武淑兰　范卫刚　范开春　林剑浩　欧阳翔英　岳　云
金　杰　周　红　周　炜　周　颖　周业平　周丽雅
庞文景　郑　毅　郑法雷　房居高　孟凡冬　孟迅吾
赵志刚　赵荣生　赵堪兴　胡　园　胡文利　施　慧
施仲伟　袁耀宗　栗占国　贾　强　贾继东　夏　寅
顾复生　顾晓明　钱家鸣　徐小薇　徐兵河　徐建国
殷大鹏　高　妍　高占成　高志强　郭代红　唐罗生
涂　平　黄　烽　黄一宁　黄绍光　梅　丹　曹小非
曹晓慈　常　明　崔一民　崔永华　崔向丽　崔荣丽
崔德健　梁旭东　彭名炜　葛　坚　韩　英　程齐俭
焦　月　鲁云兰　童朝辉　谢美慧　谢院生　谢晓慧
甄健存　鲍春德　蔡　慎　蔡柏蔷　翟所迪　黎占良
黎晓新　潘长玉　薛长勇

审　阅（以姓氏笔画为序）

王澍寰　刘又宁　李光伟　陆丽珠　罗爱伦　姜树椿
顾复生　徐贤豪　唐由之

序

随着我国经济社会和医药卫生事业的快速发展，我国医药产业随之蓬勃发展。大量新型药物的研发、生产和临床应用为解决患者药物治疗临床需求、保障人民群众身体健康发挥了重要作用。但也因此导致规范、准确、合理选用药物的难度越来越大，药物安全问题也日趋严重。

为深入贯彻党中央、国务院关于深化医药卫生体制改革的总体部署和要求，统筹兼顾、配套推进各项医改重大举措，根据世界卫生组织关于制定国家处方集指导临床合理用药的倡导与建议，卫生部委托中国医院协会组织国内两百余名著名医药学专家，在借鉴英国等西方发达国家以及世界卫生组织编写的处方集经验的基础上，结合我国地域分布、疾病谱、临床治疗习惯、经济文化等因素，历时两年，攻坚克难，数易其稿，完成了我国第一部国家处方集（化学药品与生物制品卷）的编写工作。在此，谨向本书的出版表示热烈的祝贺，并向付出艰苦、细致、创造性劳动的各位医药学专家及相关工作人员表示衷心的感谢！

合理用药是提高药物治疗水平，降低医疗费用，使患者获得优质医疗服务的必要条件，也是反映医疗水平的重要环节。强化合理用药可以为患者获得安全、有效、经济的药物治疗提供保障，同时减轻个人和政府的经济负担，具有很大的社会意义和经济意义。

党中央、国务院历来十分重视合理用药工作。近年来，全国人大、国务院先后颁布《中华人民共和国药品管理法》《中华人民共和国药品管理法实施条例》《麻醉药品和精神药品管理条例》等法律法规，加强药品监督管理，保证药品质量，保障用药安全，维护人民身体健康和用药的合法权益。在党中央、国务院的领导下，卫生部采取了一系列措施，加强药物临床应用管理，规范医务人员用药行为，推进临床合理用药。先后下发了《医疗机构药事管理暂行规定》《抗菌药物临床应用指导原则》《处方管理办法》等一系列规章和规范性文件，对临床合理用药做出了明确规定。同时，在2005年以来的“医院管理年”活动以及2009年“医疗质量万里行”活动中，临床合理用药，保证用药安全被放在了突出的位置，以指导医疗机构加强药事管理，促进合理用药，不断提高医疗质量和用药水平，更好地为人民群众健康服务。

《中共中央 国务院关于深化医药卫生体制改革的意见》中指出，医药卫生体制改革的总体目标是建立健全覆盖城乡居民的基本医疗卫生制度，为群众提供安全、有效、方便、价廉的医疗卫生服务。并在公立医院改革内容中明确提出要“规范用药、检查和医疗行为”。为深入贯彻公立医院改革工作要求，指导医疗机构规范用药行为，保障患者用药安全、有效、经济，卫生部委托中国医院协会组织专家编写了这本《中国国家处方集》。《中国国家处方集》是国家药物政策的重要体现，所遴选的药品品种涵盖了国家基本药物目录、国家医保药品目录中的全部药物和其他一些常用药物，基本满足了临床常见病、多发病及重大、疑难、复杂疾病抢救、治疗的需要。在编写上，采取“以病带药”的模式，以优先使用基本药物为药物选用原则，充分结合各专业临床经验和国际共识，就临床各系统常见的疾病用药提出了用药原则和具体药物治疗方案；涉及基本药物使用时，努力保持与《国家基本药物处方集》的一致性。这对规范医疗行为、提高临床药物应用水平、落实临床路径管理等工作奠定了重要基础，对促进医患沟通，建立和谐的医患关系也具有十分重要的意义。

编写《中国国家处方集》是一项开创性的工作，也是一项系统工程。我国人口众多，城乡、地域、医院规模之间发展很不平衡。编写一部适合我国各级各类医疗机构应用的国家处方集，绝非易事。加之医药技术飞速发展，经济和人民生活水平不断提高，需要《中国国家处方集》与时俱进，不断完善。我相信，在广大医疗卫生工作者的共同努力下，《中国国家处方集》必将在日益广泛的实践应用中，为促进我国合理用药工作发挥巨大作用。

陈竺

二〇〇九年十二月二十九日

前言

为贯彻落实《中华人民共和国药品管理法》和卫生部《处方管理办法》，完善我国药物政策体系，配合深化医药卫生体制改革，加强临床用药管理，指导临床合理用药，保障患者用药安全、有效、经济、适宜，卫生部医政司于2007年9月发文委托中国医院协会组织编写《中国国家处方集》。中国医院协会对起草《中国国家处方集》的工作高度重视，组织国内著名医药学专家，多次研究并听取意见，制订了《中国国家处方集》实施方案、编写大纲、编写通则和编写体例，在两百余名专家的共同努力下，成功完成了《中国国家处方集》(化学药品与生物制品卷)的编写工作。

《中国国家处方集》全书分为总论、各论、附录、索引。

《中国国家处方集》是国家药物政策的重要组成部分，是合理用药的专业指导性文件。本书参考了《国家基本药物目录》《临床诊疗指南》《中华人民共和国药典》《中华人民共和国药典临床用药须知》，并依据药理学、药物治疗学等专业文献编写，因此本书具有较强的科学性和专业性；本书借鉴了《世界卫生组织示范处方集》《英国国家处方集》编写的国际经验，并结合我国国情，体现中国特色，因此本书具有较强的客观性和实用性；本书还兼顾了我国地域分布、经济文化与疾病谱等因素的诸多差异，因此本书又具有全面性及代表性；由于本书将定期再版补充，所以又具有一定的可持续性和时效性。

《中国国家处方集》总论主要阐述了与合理用药有关的开具调配处方规则、药品不良反应报告与监测及特殊人群用药等重要内容。

《中国国家处方集》各论按疾病系统分为20章，收录药物1 336种，涵盖了国家基本药物目录205个西药品种和2009版医保目录1 164个西药品种。采取“以病带药”的编写模式，以优先使用基本药物为药物选用原则，充分结合各专业临床经验和国际共识，就临床上20个治疗系统中常见、多发和以药物治疗为主的199种疾病提出了用药原则和具体药物治疗方案，体现了各疾病药物治疗的精髓，并结合用药指导、重要提示、合理用药原则等为重点，强化了本书的实用性。由于部分章节如麻醉、营养与水电解质平衡、疫苗等与其他章节的特点与要求不同，

因此本书不拘泥于全书的格式一致。在所收录药物的遴选上，主要以《国家基本药物目录（基层医疗机构配备使用部分）》（2009版）化学药品和生物制品部分、《国家基本医疗保险、工伤保险和生育保险药品目录（2009年版）》西药部分共同收录的品种为主；兼顾临床实际需要，结合我国目前实际治疗用药情况，体现临床治疗的前瞻性和近期循证医学的结果。

《中国国家处方集》附录包括对医务人员经常应用的药物相互作用、静脉给药注意事项、药品使用提示标签等内容，作为各论的有益补充。

《中国国家处方集》索引包括药品名称的汉英、英汉索引及疾病名称的中文索引，以方便检索和使用。

本书读者定位于具有处方资质的执业医师和执业助理医师，以及各级药师和执业药师、执业护士和其他医药工作者。本书是我国第一部为提高医疗质量和药物治疗水平，由卫生部组织编写的规范临床用药行为、指导和促进临床合理用药的书籍。我们期望本书的出版，会对促进医疗机构合理用药、保障患者用药安全发挥重要作用。

由于是第一部国家处方集，不足之处在所难免，希望各级卫生管理部门和广大医务人员对《中国国家处方集》在实施中发现的问题，及时反馈给我们，以便再版时修正，使之能够更好地指导临床合理用药工作。

最后，我们对为本书出版付出辛勤劳动的专家及相关人员致以崇高的谢意！

《中国国家处方集》编委会办公室

二〇一〇年一月

使用指南

《中国国家处方集》在我国为首次编辑出版，现将本书的结构、内容及特点逐一介绍，作为使用指南，以便大家使用。本书包括总论、各论、附录和索引，其内容如下：

一、总　论

综述了医务人员工作中所需要的、与合理使用药物有关的一些重要知识和国家相关规定。包括以下内容：

1. 关于处方的管理规定。
2. 药品不良反应报告与监测。
3. 儿童与老年人用药。
4. 妊娠与哺乳期妇女用药。
5. 肝、肾功能不全的患者用药。

二、各　论

1. 各论按照疾病治疗系统分为20章，每章按照疾病、药物特点和具体情况又分为若干节。

2. 每章列出本章节序、节题和页码，以及介绍治疗方案的常见疾病名称，便于读者检索和阅读。

3. 各章（节）开始时一般有扼要的“综述性前言”，其内容以疾病为起点，重点描述该疾病与药物治疗密切相关的内容，然后叙述其治疗药物的类别和具体品种；结合药品在作用（如强弱、开始和持续时间等）、不良反应、使用（如给药方法、人群等）方面的特点，叙述药物的类别、各类药物的具体品种、选择药品和用药的原则及注意事项。有关药物治疗的内容主要参照我国的《临床诊疗指南》中的‘药物治疗部分’；如无相应的《临床诊疗指南》时则参照公认的的药物治疗权威书籍。

4. 在“综述性前言”之后，介绍具体的药物品种及其信息。如中文和英文通用名称、适应证、禁忌证、不良反应、注意事项、用法与用量、制剂与规格等。其中的重要内容依据药品说明书，参考《中华人民共和国药典》、《中华人民共和国药典临床用药须知》等。药品中文通用名称右上角括号内标注了该药品是否为基本药或医保药。（参见所附示例）

5．各章之间有交叉或重复之处，则根据具体的主（详）、次（简）情况分别列于不同章节，后者可按括号标注的互见章节号参见前者。

三、附　录

附录收载了与合理使用药物有密切关系的相互作用、国家基本药物目录、常用药物的皮肤敏感试验、静脉输液注意事项和调配处方时标签用语等，既便于检索，又可节约篇幅。包括：

1．肝细胞色素 P_{450} 同工酶对药物代谢的影响。

2．药物相互作用。

3．国家基本药物目录（基层医疗卫生机构配备使用部分）2009 版化学药品和生物制品部分。

4．常用药物的皮肤敏感试验。

5．静脉给药注意事项。

6．特殊药品目录。

7．部分监测药物的药动学参数。

8．药品使用提示标签。

四、索　引

书末附有汉英对照的药品名称索引（以首字汉语拼音字母为序）、英汉对照的药品名称索引（以首字英文字母为序）及疾病名称索引。从中可检索到所需信息的所在页码。

各论章节示例

章节目录

涉及的疾病

综述性前言

药物的选择

药品中英文通用名及所属类别

药品信息

第 1 章 神经与精神疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 缺血性脑血管病
- 出血性脑血管病
- 痴呆
- 帕金森病

……

1.1 脑血管病及其用药

1.1.1 缺血性脑血管病及其用药

脑血管病具有高发病率、高致残率和高病死率特点，对缺血性脑血管病的治疗不仅要追求急性期的安全、有效、及时，同时还要重视危险因素的干预，做好一级预防和二级预防工作。现重点介绍短暂性脑缺血发作（transient ischemic attack，TIA）和脑血栓形成的药物治疗。

1.1.1.1 短暂性脑缺血发作的药物治疗

（1）抗血小板药：对TIA尤其是反复发生TIA的患者应首先考虑选用抗血小板药（见4.11）。①环氧酶抑制药：大多数TIA患者首选环氧酶抑制药阿司匹林（ASA）。剂量为一日 50 ~ 150 mg，顿服。②磷酸二酯酶抑制药：磷酸二酯酶抑制药的缓释制剂双嘧达莫（DPA）(200 mg)，联合应用小剂量阿司匹林 (25 mg)，可加强其药理作用……

降纤酶[保(乙)]

Defibrase

【适应证】用于血栓栓塞性疾病，如脑血栓形成、脑栓塞、四肢动静脉血栓形成、视网膜静脉栓塞等。

【注意事项】(1) 有药物过敏史、消化道溃疡史、脑血管病后遗症、70岁以上老年人慎用。(2) 用药时不要进行大血管手术、穿刺。(3) 本品稀释后应立即使用，静脉滴注速度宜慢。(4) 用药后 5 ~ 10 日应尽量少活动，以防意外创伤。

【禁忌证】对本品及蛇毒过敏者禁用。有出血史、出血性病灶和凝血功能低下者禁用。妊娠及哺乳期妇女、儿童禁用。对正在使用抗凝药、抗血小板药者、重度肝肾功能不全者禁用。

【不良反应】(1) 常见有出血，但一般轻微，如胃肠道、泌尿生殖道、腹膜后或颅内出血、浅层的或表面的出血。(2) 少数人有头晕、疲乏、齿龈出血、皮下出血点、瘀斑，极个别严重者可发生过敏性休克。

【用法与用量】(1) 用药前应进行皮肤过敏试验，以本品 0.1 ml 加 0.9% 氯化钠注射液稀释至 1 ml，皮内注射 0.1 ml，15 分钟后观察结果，皮试阴性者方可使用。(2) 静脉滴注：成人一般首次剂量 10 BU，维持量为 5 BU，隔日 1 次，加入 0.9% 氯化钠注射液 100 ~ 200 ml 中，持续静脉滴注 1 ~ 2 小时，连续 3 ~ 4 次为 1 个疗程。

【制剂与规格】注射用降纤酶：① 5 BU；② 10 BU。

降纤酶注射液：① 5 BU；② 10 BU。

蚓激酶[保(乙)]

Lumbrokinase

【适应证】用于缺血性脑血管病中纤维蛋白原增高及血小板凝集率增高的患者。

目 录

总 论

各 论

附　录

总论

一、关于处方的管理规定

本规定系依据《处方管理办法》（中华人民共和国卫生部第53号令于2007年2月14日发布）中的有关规定编写。

（一）概 述

1．处方（prescription），是指由注册的执业医师和执业助理医师（以下简称医师）在诊疗活动中为患者开具的、由取得药学专业技术职务任职资格的药学专业技术人员（以下简称药师）审核、调配、核对，并作为患者用药凭证的医疗文书。处方包括门诊处方和医疗机构病区用药医嘱单。

2．处方除作为患者用药的凭证外，尚具有经济和法律意义，可作为药品消耗数量和药费收入金额的原始记载文件；在遇有法律问题时也可作为证据使用。各种处方应按《处方管理办法》规定的保存期限和销毁手续进行管理。

3．医师开具处方和药师调剂处方应当遵循安全、有效、经济的原则。

（二）处方书写规则

1．患者一般情况、临床诊断填写清晰、完整，并与病历记载相一致。

2．每张处方限于一名患者的用药。

3．字迹清楚，不得涂改；如需修改，医师须在修改处再次签名并注明修改日期。

4．药品名称应当使用规范的中文通用名称书写，没有中文名称的可以使用规范的英文名称书写；医疗机构或者医师、药师不得自行编制药品缩写名称或者使用代号；书写药品名称、剂量、规格、用法、用量要准确规范，药品用法可用规范的中文、英文、拉丁文或者缩写体书写，但不得使用“遵医嘱”“自用”等含糊不清字句。

5．患者年龄应当填写实足年龄，新生儿、婴幼儿写日、月龄，必要时要注明体重。

6．西药和中成药可以分别开具处方，也可以开具一张处方，中药饮片应当单独开具处方。

7．开具西药、中成药处方，每一种药品应当另起一行，每张处方不得超过5种药品。

8．药品用法用量应当按照药品说明书规定的常规用法用量使用，特殊情况需要超剂量使用时，应当注明原因并再次签名。

9．除特殊情况外，应当注明临床诊断。

10．开具处方后的空白处画一斜线以示处方完毕。

11．处方医师的签名式样和专用签章，应当与院内医务处及药学部门留样备查的式样相一致，不得任意改动，否则应当重新登记留样备案。

12．药品剂量与数量用阿拉伯数字书写。剂量应当使用法定剂量单位：重量以克（g）、毫克（mg）、微克（μg）、纳克（ng）为单位；容量以升（L）、毫升（ml）、微升（μl）为单位；国际单位（IU）、单位（U）。

片剂、丸剂、胶囊剂、颗粒剂分别以片、丸、粒、袋为单位；溶液剂以支、瓶为单位；软膏及乳膏剂以支、盒为单位；注射剂以支、瓶为单位，应当注明含量。

（三）处方开具规则

1．医疗机构应当根据本机构性质、功能、任务，制定本机构的药品处方集。

2．医师开具处方应当使用经药品监督管理部门批准并公布的药品通用名称、新活性化合物的专利药品名称和复方制剂药品名称，以及由卫生部公布的药品习惯名称。

3．开具院内制剂处方时医师应当使用经省级卫生行政部门审核、药品监督管理部门批准的名称。

4．处方开具当日有效。特殊情况下需延长有效期的，由开具处方的医师注明有效期限，但有效期最长不得超过3日。

5．医师利用计算机开具、传递普通处方时，应当同时打印出纸质处方，其格式与手写处方一致；打印的纸质处方经签名或者加盖签章后有效。药师核发药品时，应当核对打印的纸质处方，无误后发给药品，并将打印的纸质处方与计算机传递处

方同时收存备查。

6．各种药品处方的限量及要求

（1）普通药品：处方一般不得超过7日用量；急诊处方一般不得超过3日用量；对于某些慢性病、老年病或特殊情况，处方用量可适当延长，但医师应当注明理由。

（2）医疗用毒性药品及放射性药品：医疗用毒性药品、放射性药品的处方用量，应当严格按照国家有关规定执行。开具医疗用毒性药品，每张处方剂量不得超过2日极量（西药只限开制剂，不得开原料）。

（3）麻醉药品及精神药品

①医师应当按照卫生部制定的麻醉药品和精神药品临床应用指导原则，开具麻醉药品、第一类精神药品和第二类精神药品的处方。

②门（急）诊癌症疼痛患者和中、重度慢性疼痛患者需长期使用麻醉药品和第一类精神药品的，首诊医师应当亲自诊查患者，建立相应的病历，要求其签署《知情同意书》。病历中应当留存下列材料复印件：二级以上医院开具的诊断证明；患者户籍簿、身份证或者其他相关有效身份证明文件；为患者代办人员身份证明文件。

③除需长期使用麻醉药品和第一类精神药品的门（急）诊癌症疼痛患者和中、重度慢性疼痛患者外，麻醉药品注射剂仅限于医疗机构内使用。

④为门（急）诊患者开具的麻醉药品注射剂，每张处方为一次常用量；控、缓释制剂，每张处方不得超过7日常用量；其他剂型，每张处方不得超过3日常用量。

第一类精神药品注射剂，每张处方为一次常用量；控、缓释制剂，每张处方不得超过7日常用量；其他剂型，每张处方不得超过3日常用量。哌甲酯用于治疗儿童多动症时，每张处方不得超过15日常用量。

第二类精神药品，一般每张处方不得超过7日常用量；对于慢性病或某些特殊情况的患者，处方用量可以适当延长，医师应当注明理由。

⑤为门（急）诊癌症疼痛患者和中、重度慢性疼痛患者开具的麻醉药品、第一类精神药品注射剂，每张处方不得超过3日常用量；控、缓释制剂，每张处方不得超过15日常用量；其他剂型，每张处方不得超过7日常用量。

⑥为住院患者开具的麻醉药品和第一类精神药品处方应当逐日开具，每张处方为1日常用量。

⑦对于需要特别加强管制的麻醉药品，盐酸二氢埃托啡处方为1次常用量，仅限于2级以上医院内使用；盐酸哌替啶处方为1次常用量，仅限于医疗机构内使用。

⑧医疗机构应当要求长期使用麻醉药品和第一类精神药品的门（急）诊癌症患者和中、重度慢性疼痛患者，每3个月复诊或者随诊一次。

（四）处方调剂规则

1．具有药师以上专业技术职务任职资格的人员负责处方审核、评估、核对、发药以及安全用药指导；药士从事处方调配工作。

2．药师应当凭医师处方调剂处方药品，非经医师处方不得调剂。

3．药师应当按照操作规程调剂处方药品：认真审核处方，准确调配药品，正确书写药袋或粘贴标签，注明患者姓名和药品名称、用法、用量，包装；向患者交付药品时，按照药品说明书或者处方用法，进行用药交待与指导，包括每种药品的用法、用量、注意事项等。

4．药师应当认真逐项检查处方前记、正文和后记书写是否清晰、完整，并确认处方的合法性。

5．药师应当对处方用药适宜性进行审核，审核内容包括：①规定必须做皮试的药品，处方医师是否注明过敏试验及结果的判定；②处方用药与临床诊断的相符性；③剂量、用法的正确性；④选用剂型与给药途径的合理性；⑤是否有重复给药现象；⑥是否有潜在临床意义的药物相互作用和配伍禁忌；⑦其他用药不适宜情况。

6．药师审核处方后，认为存在用药不适宜时，应当告知处方医师，请其确认或者重新开具处方。药师发现严重不合理用药或者用药错误，应当拒绝调剂，及时告知处方医师，并应当记录，按照有关规定报告。

7. 药师调剂处方时必须做到“四查十对”：查处方，对科别、姓名、年龄；查药品，对药名、剂型、规格、数量；查配伍禁忌，对药品性状、用法用量；查用药合理性，对临床诊断。

8. 药师在完成处方调剂后，应当在处方上签名或者加盖专用签章。

9. 药师应当对麻醉药品和第一类精神药品处方，按年月日逐日编制顺序号。

10. 药师对于不规范处方或者不能判定其合法性的处方，不得调剂。

（五）处方监督管理规则

1. 医疗机构应当加强对本机构处方开具、调剂和保管的管理。

2. 医疗机构应当建立处方点评制度。

3. 未取得处方权的人员及被取消处方权的医师不得开具处方。未取得麻醉药品和第一类精神药品处方资格的医师不得开具麻醉药品和第一类精神药品处方。

4. 未取得药学专业技术职务任职资格的人员不得从事处方调剂工作。

5. 处方由调剂处方药品的医疗机构妥善保存。普通处方、急诊处方、儿科处方保存期限为1年，医疗用毒性药品、第二类精神药品处方保存期限为2年，麻醉药品和第一类精神药品处方保存期限为3年。

处方保存期满后，经医疗机构主要负责人批准、登记备案，方可销毁。

6. 医疗机构应当根据麻醉药品和精神药品处方开具情况，按照麻醉药品和精神药品品种、规格对其消耗量进行专册登记，登记内容包括发药日期、患者姓名、用药数量。专册保存期限为3年。

二、药品不良反应报告与监测

本文系依据《药品不良反应报告和监测管理办法》（中华人民共和国卫生部、国家食品药品监督管理局审议通过，于2004年3月4日以国家食品药品监督管理局局令第7号发布）有关内容编写。

（一）概述

1. 药品不良反应（adverse drug reaction，ADR）：是指合格药品在正常用法用量下出现的与用药目的无关的或意外的有害反应。

2. 药品不良事件（adverse drug event，ADE）：是指药物治疗期间所发生的任何不利的医疗事件，该事件并非一定与该药有因果关系。

在相关性没有弄清之前，它只能算一个不良事件，等待进一步研讨，对事件是否为药物不良反应进行肯定或否定。

3. 新的药品不良反应：是指药品说明书中未载明的不良反应。

4. 严重药品不良反应：是指因使用药品引起以下损害情形之一的反应：①引起死亡；②致癌、致畸、致出生缺陷；③对生命有危险并能够导致人体永久的或显著的伤残；④对器官功能产生永久损伤；⑤导致住院或住院时间延长。

5. 药品不良反应发生率：根据国际医学科学组织委员会（CIOMS）推荐，不良反应按其发生率分为十分常见、常见、少见、偶见、罕见、十分罕见6级。它们的发生率分别如下：十分常见≥10%，常见为2%～10%，少见为1%～2%，偶见为0.1%～1%，罕见为0.01%～0.1%，十分罕见＜0.01%。

6. 为保证公众用药安全，国家实行药品不良反应报告制度。药品生产企业、药品经营企业、医疗卫生机构应按规定报告所发现的药品不良反应。

7. 药品不良反应报告的内容和统计资料是加强药品监督管理、指导合理用药的依据，不作为医疗事故、医疗诉讼和处理药品质量事故的依据。

（二）报告与监测

1. 药品不良反应报告和监测 是指药品不良反应的发现、报告、评价和控制的过程。

2. 药品不良反应实行逐级、定期报告制度，必要时可以越级报告。

3. 药品生产、经营企业和医疗卫生机构必须指定专（兼）职人员负责本单位生产、经营、使用药品的不良反应报告和监测工作，发现可能与用药有关的不良反应应详细记录、调查、分析、评价、处理，

并填写《药品不良反应／事件报告表》，每季度集中向所在地的省、自治区、直辖市药品不良反应监测中心报告，其中新的或严重的药品不良反应应于发现之日起15日内报告，死亡病例须及时报告。

4．《药品不良反应／事件报告表》的填报内容应真实、完整、准确。

5．新药监测期内的药品应报告该药品发生的所有不良反应；新药监测期已满的药品，报告该药品引起的新的和严重的不良反应。

6．药品生产、经营企业和医疗卫生机构发现群体不良反应，应立即向所在地的省、自治区、直辖市（食品）药品监督管理局、卫生厅（局）以及药品不良反应监测中心报告。省、自治区、直辖市（食品）药品监督管理局应立即会同同级卫生厅（局）组织调查核实，并向国家食品药品监督管理局、卫生部和国家药品不良反应监测中心报告。

（三）评价与控制

1．药品生产、经营企业和医疗卫生机构应经常对本单位生产、经营、使用的药品所发生的不良反应进行分析、评价，并应采取有效措施减少和防止药品不良反应的重复发生。

2．国家食品药品监督管理局定期通报国家药品不良反应报告和监测情况。

三、儿童与老年人用药

（一）儿童用药

1．儿童生理特点

（1）儿童是生长发育中的机体：从医学角度看，儿童不是成人的缩影，而是处于生长发育中的机体，其解剖生理特点和疾病的临床表现与成人有很大差别。儿童的许多脏器（如心、肝、肾）及神经系统的功能发育尚不完善，免疫机制亦不健全，因而对药物也具有特殊的反应。在儿童的年龄范围内，自出生到青春发育成熟，其全身器官和组织逐步成长，体格、心理和精神状态均在不断发育的过程中，年龄越小，与成人的差别越大（尤其是新生儿和婴幼儿）。因此，对防治儿童疾病必须考虑其生理特点及用药特殊性。

（2）儿童按年龄分期。我国儿童年龄范围为：自出生至18周岁。为分析儿童生长发育各阶段对药物处置及反应情况，将儿童按年龄做以下分期，见总表-1：

总表-1　儿童各期发育特点

分期	年龄	发育特点
新生儿期	自胎儿娩出脐带结扎至28日	适应环境阶段，各项生理功能还不完善和协调
婴儿期	自出生后～1周岁之前	体格生长迅速，脑发育很快，各系统器官的生长发育虽在继续进行，但还不够成熟完善
幼儿期	自1～3周岁之前	生长速度稍减慢，智能发育迅速，消化系统功能仍不完善
学龄前期	自3～6-7周岁之前	生长速度较慢，神经心理发育更趋完善，智能发育更加迅速
学龄期	自6-7～12周岁之前	体格生长稳步增长，多种生理功能已基本成熟，除生殖器官外，其他器官发育基本接近成人水平
青春期	自12～18周岁	这是儿童过渡到成人的发育阶段，但个体差异很大，与地区、气候、种族及性别有关。女孩的青春期开始和结束年龄均比男孩早2年。青春期，儿童体格生长速率出现第二高峰，生殖系统发育成熟，生理发育达到新的水平

学龄前儿童（6～7周岁之前）称为小儿

2. 儿童药动学特点：儿童由于生理方面的特点，使得药物在其体内的药动学过程与成人有一定的差异。

(1) 吸收

口服给药 口服在胃肠道的吸收程度，受胃内酸度、胃排空时间、病理状态、药物性质及个体差异的影响。儿童不同时期存在差异：①新生儿及婴幼儿胃酸过低或缺乏，直到3岁左右才稳定在成人水平。胃蠕动差，胃排空时间延长达6～8小时(6～8个月才接近成人水平)，因此新生儿口服药物吸收的量难以预料，胃肠吸收功能有较大差异。②婴幼儿胃内酸度仍低于成人，故对药物的吸收与成人也不尽相同，不过胃排空时间较新生儿短，在十二指肠吸收的药物吸收时间快于新生儿。③较大儿童胃肠道对药物的吸收已接近成人，但首关消除能力强，对于首关效应较强的药物（如普萘洛尔等）生物利用度低，个体差异大。

皮肤、黏膜给药 新生儿、婴幼儿的皮肤、黏膜面积相对较成人大，且皮肤角化层薄，黏膜娇嫩，某些药物可通过口腔、直肠、鼻、眼等黏膜和皮肤吸收。但是，由于吸收速率快，作用强，尤其皮肤有炎症或破损时，吸收的更多，可引起一些药物（如硼酸、水杨酸、糖皮质激素等）发生不良反应甚至中毒。虽应用有限，亦应引起警惕。

肌内注射 由于小儿（学龄前儿童）臀部肌肉不发达，肌内纤维软弱，故油脂类药物难以吸收，易造成局部非化脓性炎症。另外，由于局部血流量及肌肉容量少，故肌内注射后药物吸收不佳。

皮下注射 由于小儿皮下脂肪少，注射容量有限，且易发生感染，故皮下注射亦不适宜。

静脉注射 药物吸收速度快，药效可靠，是危重病儿可靠的给药途径。

(2) 分布：许多因素影响儿童的药物分布，例如体液组分、血浆蛋白结合、血－脑脊液屏障等。新生儿、婴幼儿药物分布与成人差异明显。

①体液组分：儿童的体液量、细胞外液、间质液均相对高于成人。如新生儿的体液、细胞外液分别占体重的80%和45%，1岁婴儿的体液、细胞外液分别占体重的70%和30%，儿童的体液占体重的65%，而成人上述两项的比例分别为60%和15%～20%。因此，对于儿童来说，水溶性药物的分布容积增大，一是可以降低药物峰浓度而减低药物的最大效应，二是减慢药物消除，延长药物作用维持的时间。这说明，若欲达到与成人相似的血浆药物浓度，儿童需要较大的初始药物剂量，而且首剂量之后给药间隔需延长。

婴儿、特别是新生儿体脂肪与体重的比例低于成人。早产儿体脂肪的含量仅占其体重的1%～3%；而足月儿，则占其体重的12%～15%。随着年龄的增长，体脂肪含量有所增加。幼儿脂溶性药物分布容积较新生儿期大。体脂肪比值的高低，可影响脂溶性药物的分布。由于新生儿、婴幼儿脂肪含量低，脂溶性药物不能与其充分结合，分布容积小，血浆中游离药物浓度升高，这是新生儿容易出现药物中毒的原因之一。同时，新生儿、婴幼儿的脑占身体比例较成人大得多，而脑组织富含脂质，血脑屏障发育又不完全，通透性较成人大，使得脂溶性药物易分布入脑，这是新生儿、婴幼儿容易出现中枢神经系统反应的重要机制之一。

②药物与血浆蛋白结合率：影响药物分布最重要的因素是药物与血浆蛋白的结合。新生儿、婴幼儿体内药物与血浆蛋白结合率比成人低，其主要原因：新生儿、婴幼儿血浆蛋白含量低，且与药物的亲和力低，结合能力弱。因此血浆中游离药物浓度高，药物易进入组织细胞，药效加强并引起不良反应。另外，由于新生儿血中有较多的胆红素或游离脂肪酸，它们与血浆蛋白的亲和力高，与药物竞争血浆蛋白，使游离药物浓度增高。

(3) 代谢：药物在体内代谢的主要场所是肝脏。肝脏代谢药物的酶系统，有肝微粒体酶和葡糖醛酸转移酶等，参与药物氧化、还原、水解、结合等过程，最后使代谢产物排出体外。新生儿、婴幼儿肝脏酶系统发育尚不成熟，各种酶活性低，使代谢减慢，$t_{1/2}$延长，易致药物在体内蓄积中毒，且个体差异较大。例如，用一般剂量氯霉素，因与葡糖醛酸结合较少而在

新生儿体内代谢较慢，故可引起“灰婴综合征”，磺胺类药物可使葡糖醛酸转移酶缺乏的新生儿出现溶血。新生儿在出生后1 ~ 4周，应慎用或减量使用在肝脏代谢的药物，如地西泮、苯妥英钠、地高辛等。幼儿、学龄儿童对某些药物在肝脏的代谢能力有所提高，如茶碱、地西泮、苯妥英钠等，血浆 $t_{1/2}$ 较成人短。要注意肝代谢酶诱导药或抑制药对新生儿药物代谢的影响。

（4）排泄：肾脏是药物排泄的主要器官。儿童年龄越小，肾功能越不完善。婴幼儿、新生儿肾功能发育不全。肾小球滤过率、肾小管排泌能力、肾有效血流量均远较成人或年长儿低。肾小管重吸收、尿浓缩、钠离子交换、酸碱平衡功能也差，特别是新生儿，可使药物排泄减慢，$t_{1/2}$ 延长。如，氯霉素在新生儿半衰期为250小时，而成人仅为4小时。因此，在新生儿与儿童时期，使用的药物剂量不能相同。一般新生儿用药剂量要酌情减少，间隔时间应适当延长。

3. 儿童用药剂量：儿童，特别是新生儿，对药物的反应不同于成年人，因此儿童用药剂量较成年人更须准确。其计算方法：应按药品说明书推荐的儿童剂量（每千克或每平方米用量）按儿童体重或体表面积计算。如药品说明书无儿童剂量，可根据儿童年龄、体重、体表面积及成人剂量换算。具体方法如下。

（1）按儿童体重计算

①根据药品说明书推荐的儿童剂量按儿童体重计算：

每次（日）剂量＝儿童体重 × 每次（日）药量 /kg

此方法科学方便，为临床常用的最基本的计算方法。

②根据成人用药剂量按儿童体重计算：儿童剂量＝成人剂量 × 儿童体重 / 70 kg

此方法仅用于药品说明书中未提供儿童剂量时，简单易记，但对年幼儿剂量偏小，而对年长儿，特别是体重过重儿，剂量偏大。因此，用此法计算剂量时应同时考虑年龄因素，年龄越小所需剂量应相对大些，故常以高限数值计算。例如，地高辛口服的饱和量，2岁以下为0.06 ~ 0.08 mg/kg，2岁以上为0.04 ~ 0.06 mg/kg。这是因为药物代谢与体表面积有关，年龄越小，体表面积相对越大，则用药量相对越多。较大儿童按体重计算，所得剂量超过成人剂量时，则以成人剂量为限。

正常儿童体重计算方法：

1岁以下儿童体重

1 ~ 6个月儿童体重（kg）＝3（出生时体重）＋月龄 ×0.6

7 ~ 12个月儿童体重（kg）＝3（出生时体重）＋月龄 ×0.5

1岁以上儿童体重

体重（kg）＝年龄 ×2 + 8

注：视儿童营养状况适当增减。如某些药物要求计算准确，或由于营养问题致体重与年龄不相符时，则需具体称出实际体重。

（2）按儿童年龄计算

①1岁以内剂量＝0.01×（月龄＋3）× 成人剂量

1岁以上剂量＝0.05×（年龄＋2）× 成人剂量

② Fried公式：婴儿剂量＝月龄 × 成人量 /150

③ Young公式：儿童剂量＝年龄 × 成人量 /（年龄＋12）

根据年龄计算剂量的方法，虽然比较方便但不精确，不太实用，很少被儿科医师采用。但对于某些剂量不需十分精确的药物，如止咳化痰药、助消化药，仍有根据年龄计算的。一般止咳合剂的用量，可按每次每岁1 ml计算，最多每次10 ml。

（3）按体表面积计算

①儿童剂量＝儿童体表面积（m^2）× 每次（日）剂量 /m^2（药品说明书按体表面积已推荐儿童药量）

②儿童剂量＝成人剂量 × 儿童体表面积（m^2）/1.73 m^2（药品说明书未按体表面积推荐儿童药量）

由于很多生理过程（如基础代谢、肾小球滤过率等）与体表面积的关系比与体重、年龄更为密切，因此按体表面积计算剂量最为合理，适用于各个年龄段，包括新生儿至成年人，即不论任何年龄，其每

平方米体表面积的用药剂量是相同的。该法虽比较繁琐，但适用于安全范围窄、毒性较大的药物。如抗肿瘤药、激素等，应以体表面积计算剂量。

体表面积[body surface area(BSA)]的计算方法

成人的BSA（按体重70 kg计算）为1.73 m^2。

儿童的BSA的计算如下：

①体重低于30 kg儿童的BSA(m^2)=(年龄+5）×0.07

或BSA（m^2）=0.035（m^2/kg）×体重（kg）+0.1（m^2）

②体重>30 kg的儿童，在30 kg体重的BSA=1.15 m^2的基础上，每增加体重5 kg，BSA增加0.1 m^2，如35 kg的儿童为1.25 m^2。体重超过50 kg时，则每增加体重10 kg，BSA增加0.1 m^2。

儿童年龄-体重-体表面积折算，见总表-2。

4．儿童用药注意事项 儿童用药除注意成人用药原则（即全面了解所用药物及病人的情况）外，由于儿童具有许多解剖生理特点，对药物的耐受性、反应性与成人不尽相同，而且儿童的病情多较急、变化快，用药更需确切及时。因此，必须熟悉儿科用药的药物选择、给药方法、剂量计算、药品不良反应及儿童禁用的药物等方面的特点，以便取得良好的治疗效果，尽量避免或减少不良反应和药源性疾病。

（1）熟悉儿童特点，明确诊断，合理选药：临床医师和药师应了解儿童不同发育时期的解剖生理特点、药物的特殊反应，严格掌握用药指征，在明确诊断的情况下，应慎重合理选择，不可滥用。药物种类不宜过多，可用可不用的药物尽量不用。在合并应用几种药物时，应注意避免由于药物在体内的相互作用而产生不良反应或药效抵消等问题。就几种临床常见病关于药物的选择列举如下。

①抗感染药物：儿童易患感染性疾病，且多为急性感染，病情变化快，故抗感染药物较常应用。应根据不同病种、病情轻重、年龄大小等选择用药。如临床已肯定诊断为病毒性感染（如麻疹、风疹、流感等），可选用抗病毒药物或某些中草药制剂，而不用抗菌药物。认为应用抗菌药物可以预防继发细菌感染的看法并无根据。滥用抗菌药物，可因各种不良反应给患儿造成不良后果。因此，儿童用抗菌药物必须慎重考虑适应证和不良反应。开始时根据患儿临床症状、体征及有关的实验室检查结果进行经验用药，待细菌培养和药敏试验结果出来后，有针对性地选用。通常以应用一种抗菌药为宜，但如感染严重亦可联合用药。

总表-2 儿童年龄-体重-体表面积折算

年 龄	体重（kg）	体表面积（m^2）	年 龄	体重（kg）	体表面积（m^2）
出生	3	0.21	4岁	16	0.66
1月龄	4	0.24	5岁	18	0.73
2月龄	4.5	0.26	6岁	20	0.80
3月龄	5	0.27	7岁	22	0.89
4月龄	5.5	0.28	8岁	24	0.94
5月龄	6	0.31	9岁	26	1.00
6月龄	6.5	0.33	10岁	28	1.08
7月龄	7	0.35	11岁	30	1.15
8月龄	7.5	0.36	12岁	33	1.19
9月龄	8	0.38	13岁	36	1.26
10月龄	8.5	0.40	14岁	40	1.33
11月龄	9	0.42	15岁	45	1.43
12月龄	10	0.44	16岁	50	1.50
2岁	12	0.52	17岁	55	1.55
3岁	14	0.59	18岁	60	1.60

②退热药物：一般选用对乙酰氨基酚和布洛芬，疗效确切，相对安全。特别是布洛芬解热镇痛效果强，不良反应小。但用上述药剂量不宜过大。

③镇静、抗惊厥药物：小儿有高热、过度兴奋、烦躁不安、频繁呕吐、惊厥等情况下，可给予镇静药，使其得到休息，以利于病情恢复。常用的药物有苯巴比妥、水合氯醛、地西泮（安定）等可镇静、抗惊厥。在使用镇静药前，必须重视原发病的诊断，否则用药后症状被掩盖，容易引起误诊。

④镇咳、祛痰、止喘药物：咳嗽有清除呼吸道分泌物的作用。小儿呼吸道较窄，发炎时黏膜肿胀，渗出物较多，容易引起呼吸道梗阻而出现呼吸困难。因此在呼吸道感染（尤其是肺炎）时，应多用祛痰药，口服或雾化吸入，如氨溴索口服液，少用镇咳药，尤其要慎用作用较强的镇咳药（如可待因）。一般对于咳嗽严重、引起小儿精神紧张或影响休息时才用镇咳药。小儿哮喘，提倡局部吸入 β_2 受体激动药类药物，必要时也可用茶碱类，但新生儿、小婴儿慎用。

⑤泻药和止泻药：婴儿便秘应先调整饮食，如奶内多加糖，或喂蜂蜜，膳食中增加蔬菜、水果等。偶尔可用栓剂，如甘油栓、开塞露、肥皂条等。仅在十分必要时才用缓泻药。婴儿腹泻时应予饮食疗法、控制感染及液体疗法等，或辅以双歧杆菌或乳酸杆菌的制剂，以调节肠道的微生态环境；不宜首选止泻药，因为用药后腹泻虽可减轻，但肠道毒素吸收增加，可使全身中毒症状加重。

⑥糖皮质激素：糖皮质激素类药物在儿科应用较为广泛。可局部（如治疗湿疹等）或全身，短期或长期使用。短疗程口服，多用于哮喘发作、严重感染（与抗生素合用）及过敏性疾病。重症病例需大量静脉给药。中疗程（几周或数月），多用于白血病、肾病综合征及免疫性疾病。长期（数年）用药，儿科少用。此类药物亦应避免滥用，因用药后可使机体免疫力、反应性降低，往往掩盖了原发病的性质，虽然自觉症状好转而病情却在发展，因而延误了诊断和治疗。较长时间用药，对水、盐、蛋白质、脂肪代谢均有不良影响，还能抑制骨骼增长，影响体格发育，并可引起骨质疏松、肌肉萎缩和皮质醇增多症即库欣综合征，患儿的肾上腺皮质可发生萎缩。

应特别指出，患水痘的儿童禁用肾上腺皮质激素，因为用药后可使病情急剧恶化，甚至死亡。若在激素治疗过程中发生水痘，应视情况减量或停药。

⑦其他药物：儿童对影响水盐代谢、酸碱平衡的药物较敏感，在应用利尿药后较易发生低钠血症或低钾血症。早产儿、新生儿应用维生素 K、磺胺类等，可发生高胆红素血症，甚至引起胆红素脑病，故上述药物应慎用。

（2）严格掌握用药剂量，并根据具体情况进行调整：药物剂量应随儿童年龄（日龄、月龄）及病情不同而不同，避免机械地按照成人剂量简单缩减。对于新生儿的用药剂量和给药间隔时间，近年多主张通过监测药物的血药浓度指导药物的剂量，根据药物的半衰期决定给药间隔时间，尤其是对那些治疗量与中毒量接近的药物及不良反应较大的药物。采用此种方法使药物在体内既可达到有效治疗浓度又能避免发生不良反应。

前面介绍了 3 种计算和折算儿童用药剂量的方法，但无论采用何种方法，所得数据都有其局限性，在具体应用时还须结合患儿的下列情况加以调整。

①生理特点：新生儿、早产儿肝肾功能不成熟，解毒、排泄功能均较差，用药剂量应偏小，甚至仅给半量。

②疾病种类与病情：重症要用大量，例如，磺胺类治疗一般感染，一日应用 50 ~ 100 mg/kg 即可，但治疗流行性脑膜炎，则需一日 150 ~ 200 mg/kg。再如，青霉素治疗一般感染，一日用 3 万 ~ 5 万 U/kg 即可；而治疗化脓性脑膜炎时的剂量，甚至需加大 10 倍以上。当肝、肾功能受损时，应用某些药物的剂量应减小。

③用药目的：同一种药物因用药目的不同而剂量不同。如苯巴比妥用于抗惊厥剂量要大，用于镇静则剂量要小；阿托品用于抢救中毒性休克的剂量，比用于腹痛解痉的用量要大几倍至几十倍。

④用药途径：同一药物，灌肠法给药

比口服量要大，静脉注射法给药比口服量要小。

如果使用新的或潜在有毒的药物，应注意严格按照药品说明书推荐的剂量。

（3）根据儿童不同时期特点，确定适合的剂型及给药途径。

根据年龄、病情，选择适合的剂型及给药途径。用药种类及给药次数不宜过多。

①口服：能口服者尽量口服，以减少注射给药对患儿带来的不良刺激。婴幼儿及不能吞咽药片的儿童，最好用水剂（糖浆剂）、冲剂，或临时将药片压碎用糖水溶化后再服。对液体口服制剂，在提供的量器中不要加其他任何药物或食物，以免产生相互作用或影响剂量准确性。给小婴儿喂药时应将其抱起，使成半卧位，用小勺慢慢将药液从嘴角灌入，使药液达舌根部后即可咽下。对较大的儿童，应首先鼓励其自己吃药，必要时强制喂药，但动作要迅速，以防儿童将药吐出引起呛咳。可用拇指及示指紧按两颊，使上下颌分开，将匙留在上下牙之间，直至将药咽下为止。有味的药物不可与食物放在一起喂服，以免引起拒食，造成喂药困难。不应将药物交给较大患儿让其自己掌握，以免发生误服或隐瞒不服的情况。

②注射：药物作用发挥较口服快。重症、急症或有呕吐者多用。新生儿静脉给药可直接进入血液循环，对危重新生儿是较可靠的给药途径。但是要按规定速度滴注，不可过快过急。要防止药液渗出引起组织坏死。对于婴幼儿、学龄前及学龄儿童，可根据病情、药物特点选用合适的注射方法。

③皮肤外用：由于新生儿体表面积相对较大，皮肤角层薄，故药物经皮肤吸收较成人迅速广泛，尤其在皮肤有炎症或破损时，吸收更多。有的药物（如碘酊、硼酸、糖皮质激素等）经皮肤吸收过多，可发生中毒反应，因此应严格控制给药剂量，并注意观察。外用药应注意避免患儿用手揉入眼中或吃入口中。

④其他：只能口服的药物（如中药汤剂），对昏迷患儿可用胃管鼻饲法灌入。舌下、含漱、吸入等给药方法，仅用于能合作的较大患儿。

灌肠法，因药物不易吸收，小婴儿又难以保留药液，故采用不多；可用缓释栓剂肛门给药，如预防高热、惊厥用直肠安定栓剂等。

（4）注意儿童用药过程中发生的不良反应：一旦发现药品不良反应，应立即停药并及时采取治疗措施，同时针对原患疾病更换其他药物治疗。对所发生的药品不良反应要填表、评价，上报药品不良反应监测中心。值得关注的是，对于儿童在用药过程中发生的所有可疑的药品不良反应均应上报。鉴定和报告儿童的药品不良反应尤为重要，因为：①在药品上市前的临床研究中，儿童不作为受试对象；②药物对儿童的作用和药动学与成人有很大的差异；③有些药物尚未广泛用于儿童；④许多药物没有通过许可就用于儿童，属于超适应证用药；⑤药物制剂中虽有适合儿童的成分，但却没有适合儿童的剂量；⑥疾病状态和病程与药品不良反应，在成人和儿童之间是不同的。

国家药品不良反应监测中心，对儿童用药发生的严重不良反应，应汇总通报，并提出相应措施，以提高儿童用药安全性。

（5）儿童禁用或慎用的药物：由于儿童在成长发育的各阶段，有许多解剖和生理的特点，因而对药物的耐受性和反应性不仅与成人不尽相同，而且在儿童年龄范围内，自出生到青春发育期也不尽相同。因此，成人能用的药物对于儿童可能是禁用或慎用，如喹诺酮类抗菌药物 18 岁以下儿童禁用。较大儿童能用的药物，对较小儿童可能是禁用或慎用，如四环素类抗生素 8 岁以下儿童禁用。还有许多药物，对早产儿、新生儿、婴幼儿是禁用的。故临床医生给儿童用药时，必须依据药品说明书，决定该药品可用、慎用或禁用。

以下仅列举不同年龄段儿童部分禁用和慎用药品，供用药参考。

①儿童禁用药物：见总表-3。2007年，英国药品和健康产品管理局（MHRA）公告，已不再批准下述药物用于 2 岁以下儿童。抗组胺类药：溴苯那敏、氯苯那敏和苯海拉明；镇咳药：右美沙芬、福尔可定；祛痰药：愈创甘油醚、吐根；减充血药：去氧肾上腺素、伪麻黄碱、麻黄碱、羟甲唑啉、赛洛唑啉。

总表 -3 儿童禁用的药物

类别	药名
抗菌药物	四环素类（8 岁以下）、磺胺类（新生儿）、硝基呋喃类（新生儿）、杆菌肽（新生儿）、乙胺丁醇（新生儿）、氟喹诺酮类（出生至 18 岁）
神经系统药物	苯丙胺（婴幼儿）、氟哌啶（婴幼儿）、羟嗪（婴儿）、左旋多巴（3 岁以下）、硫喷妥钠（6 个月内）
其他药物	丙磺舒（2 岁以下）、依他尼酸（婴儿）、苯海拉明（早产儿、新生儿）、酚酞（婴儿）、噻嘧啶（婴儿）、甲氧氯普胺（婴幼儿）

②儿童慎用药：有些药物虽不严格禁用，但使用中应特别注意，如有代替品最好不用。

氯霉素——该药除对骨髓有抑制作用外，新生儿使用后，由于缺乏葡糖醛酸转移酶而无法结合成无活性的衍生物，致使血中游离氯霉素增多，引起中毒，致新生儿“灰婴综合征”。

氨基糖苷类抗生素——该类药不仅对儿童、对成人同样有耳毒性，但对儿童的危害更大，因幼儿尚未掌握语言能力，可引起聋哑。另外，该类药尚可引起肾毒性和神经－肌肉阻滞不良反应。

双氯芬酸——该药可使肾小管收缩，对儿童造成不同程度的肾损害而致血尿，还可因儿童肝、肾功能发育不全而致蓄积中毒。故含双氯芬酸的复方制剂儿童慎用。

阿司匹林——该药用于儿童退热。临床发现有 5% ~ 15% 的哮喘患儿，在服用本品后引起哮喘发作。新生儿使用含阿司匹林的制剂，易在胃内形成黏膜糜烂，系由于新生儿胃内酸度低，胃排空迟缓，药物吸收慢所致。

（6）儿科用药的色、香、味及外观，应有一定要求，使儿童易接受用药。剂量应能准确分割，或药品规格单剂量化，以提高药物治疗的依从性，提高疗效。说明书应通俗易懂，以便家长掌握，正确执行医嘱。

（二）老年人用药

随着社会发展和医学进步，人类寿命正在延长。人口老龄化日益明显。我国统计显示，目前 60 岁以上老年人口占国内总人口的 10% 以上，65 岁以上的老年人占总人口的 7% 以上。中国已在步入老龄社会。老年人的特点是生理和心理等方面均处于衰退状态。许多老年人同时患有多种疾病，通常为慢性病，需要长期治疗，因此用药种类较多，药物因素引起的药源性损害也明显增加。因此，对老年人用药问题进行关注和研究，是保证老年患者有效和安全用药的重要措施，同时也可避免过度的和不必要的卫生资源的浪费。

为使老年患者合理用药，应了解老年人各系统器官和组织生理、生化功能及病理、生理学所发生的特征性改变，以及老年人药动学和药效学的特点，对于正确使用药物、减少或避免不良反应以及药源性疾病尤为重要。

1．老年人药动学特点

（1）吸收：老年人胃肠道肌肉纤维萎缩，张力降低，胃排空延缓，胃酸分泌减少，一些酸性药物解离部分增多，吸收减少。胃排空时间延迟，小肠黏膜表面积减少，胃肠道血流量减少，有效吸收面积减少。胃肠功能的变化，对被动扩散方式吸收的药物几乎没有影响，如阿司匹林、对乙酰氨基酚、复方磺胺甲噁唑等，但对于按主动转运方式吸收的药物，如维生素 B_1、维生素 B_6、维生素 B_{12}、维生素 C、铁剂、钙剂等需要载体参与吸收的药物，则吸收减少，营养素的吸收也减少。

（2）分布：老年人机体的组成成分、血浆蛋白结合率、组织器官的血液循环等，都有不同程度的变化，从而影响体内药物的分布。①老年人体内水分和体重的比例随年龄增长而下降，而体内脂肪随年龄增长而增加，非脂肪组织则逐渐减少。水溶性强的药物，如对乙酰氨基酚、乙酰唑胺、阿替洛尔等分布容积随年龄增长而降低，即相对在血浆中有较高的浓度，因此效应

相对增强；脂溶性强的药物，如硫喷妥钠、普萘洛尔、胺碘酮、地西泮等分布容积随年龄增长而增大，半衰期相应延长，峰值则相反降低。②老年人血浆蛋白含量降低，直接影响药物与蛋白的结合，使游离药物浓度增加，作用增强。如华法林的血浆蛋白结合率高，因老年人血浆蛋白降低，使血中具有活性的游离型药物比结合型药物多，常规用量就有造成出血的危险。口服降糖药、长效磺胺等均属于蛋白结合率高的药物，应予注意。

（3）代谢：肝脏是药物代谢和解毒的主要场所。老年人由于肝重量减轻，肝细胞和肝血流量下降，肝微粒体药酶合成减少，活性降低，药物代谢减慢，半衰期延长，使药物在体内易积蓄，产生不良反应，故应适当减量，如利多卡因、苯巴比妥、普萘洛尔、哌唑嗪、阿司匹林等。反之，一些需经肝脏代谢活化的前体药物，在老年人的作用或毒性可能降低。另外，由于老年人的肝血流量比年轻人减少40%～45%，因此，对肝脏代谢率高、且首关效应显著的药物（如硝酸甘油、水杨酰胺、利多卡因等），生物利用度增加，70岁老年人稳态血药浓度为40岁者4倍。

老年人肝脏药物代谢酶活性，其个体差异大于年龄差异，而且目前尚无临床检验可直接反映肝脏的药物代谢能力，因而需强调老年人用药剂量的个体化。

（4）排泄：肾脏是药物排泄的主要器官。由于老年人肾脏萎缩，血管硬化，血流量减少，老年人的肾脏功能仅为年轻人的1/2。而且部分老年人因某些慢性疾病影响肾脏的血流灌注，肾脏的血流量减少。这些因素均可影响药物排泄，使药物在体内积蓄，容易产生不良反应或中毒。肾小球随年龄增长而逐渐纤维化，当老年人使用经肾排泄的常规治疗量药物时，容易出现蓄积中毒。特别是使用地高辛、四环素类、头孢菌素类、氨基糖苷类抗生素、苯巴比妥、磺胺类、普萘洛尔、锂盐等药物时，更应慎重，严格控制用药剂量。

2．老年人的药效学特点　对于老年人药效学改变的研究远不及药动学深入。老年人机体各器官结构功能退化，适应力减退，体内调节功能下降，药动学性质改变，可使药物达到作用部位或受体的血药浓度改变，引起细胞与受体数量和反应性改变，可能是药效学改变的因素。

（1）神经系统变化对药效学的影响：老年脑萎缩，脑神经细胞数量减少，脑血流量减少，酶活性减弱或靶组织中受体数目和结合力改变，神经递质代谢和功能变化，均可影响药效。苯丙胺、士的宁等中枢兴奋药作用减弱。中枢抑制药，如巴比妥类和地西泮易引起老年人精神错乱和共济失调。中枢抑制性降压药利血平或氯丙嗪、抗组胺药及糖皮质激素等，可引起明显的精神抑制和自杀倾向。氨基糖苷类抗生素、依他尼酸等易致听力损害。老年人由于心脏的神经和胆碱能受体减少，所以阿托品使心率加快的作用仅为年轻人的1/5。

（2）心血管系统的变化对药效学的影响：老年人心血管系统的功能减退，每搏心排血量、心脏指数及动脉顺应性下降。而总外周阻力上升，动脉压增高，循环时间延长，压力感受器的反射调节功能降低，心脏和自主神经系统反应障碍，因此心脏对缺氧、儿茶酚胺、高碳酸等刺激的反应明显下降，对异丙肾上腺素反应性降低，且对β_1、β_2受体的反应性亦减弱。β受体拮抗药普萘洛尔减慢心率的作用减弱，但同时也应考虑由于其在老年人的首关效应减弱而血药浓度增高。不过，老年人对利尿药、亚硝酸盐类、抗高血压药等敏感性增高，药理作用增强，在正常血药浓度即可引起直立性低血压。另外，由于老年人肝合成凝血因子的能力减退并血管发生退行性病变而致止血反应减弱，故对肝素和口服抗凝药非常敏感，一般治疗剂量可引起持久凝血障碍，并有自发性内出血的危险。老年人对洋地黄类强心苷也十分敏感，应用这两类药时应控制剂量并注意密切观察。

（3）内分泌系统的变化对药效的影响：随着年龄的增长内分泌功能发生改变，各种激素的分泌产生变化，与此相适应的各种激素受体数量的改变，从而导致对药物反应性的差别。老年人许多甾体激素的受体，如糖皮质激素受体数量约减少16%，这对营养物质的转运和代谢的调控

能力降低相一致，但老年人对同化代谢／异化代谢呈负平衡，对皮质激素促进蛋白异化作用敏感性增高，易致骨质疏松，甚至自然病理性骨折。老年人对胰岛素和葡萄糖的耐受力下降，大脑对低血糖的耐受力亦差，在使用胰岛素时，易引起低血糖反应，甚至昏迷。试验还证明，吗啡对老年人的镇痛作用在夜间明显降低，这可能因松果腺激素和褪褐素分泌的减少有关，因为它们不但提高吗啡白昼的镇痛水平，亦能反转夜间降低镇痛的作用。老年人的细胞免疫和体液免疫功能减弱，一般主张对无肝、肾功能障碍患者，抗菌药物的剂量可稍增加或疗程适当延长，以防感染复发，但需注意变态反应，因骨髓抑制、过敏性肝炎及间质性肾炎等发生率不比年轻人低。

（4）老年人对某些药物的耐受性降低：老年人的中枢神经系统有些受体处于高敏状态。某些药物小剂量即可引起治疗作用，常规治疗剂量可引起较强的药理反应，出现耐受性降低现象。如对抗惊厥药、苯二氮䓬类、三环类抗抑郁药等较敏感。这类药物可能严重干扰老年人的中枢神经系统功能，从而引起精神错乱、烦躁、抑郁、激动、幻觉、失眠等临床症状。

3. 老年人常用药物的不良反应　临床研究表明，药品不良反应发生率随年龄增长而增加。主要原因是：①老年人基础疾病较多，用药品种多，而且用药时间较长，容易出现药物相互作用和蓄积；②老年人的药动学特性发生改变，药物的生物转化减慢，血药浓度保持在较高水平，不良反应增加；③随着年龄的增长，体内稳态机制变差，药物效应相对增强；④老年人的各系统，尤其是中枢神经系统对多种药物敏感性增加；⑤人体的免疫机制，随年龄增加而发生改变，可能出现变态反应。老年人的不良反应还有其特殊性，临床表现更为严重，且药理作用更为广泛。老年人用药的不良反应经常是不明确的，也存在非特异性。主要症状（可能是任何常用药物导致）经常是杂乱的。为了判断不良反应可能是所用药物中的哪一种引起的，以便及时停药并采取相应措施，现将常用药物的不良反应做如下叙述。

（1）镇静催眠药：许多镇静催眠药半衰期较长，产生严重的宿醉效应，如困倦、共济失调、语言不清、意识混乱等。老年人应使用半衰期短的药物，帮助患者顺利度过疾病急性期，但是应尽早停药，避免产生药物依赖性。目前临床常用的为苯二氮䓬类药物，如地西泮等。该类药易引起中枢神经系统抑制，表现有嗜睡、四肢无力、神志不清及语言不清等。长期应用苯二氮䓬类药物可引起老年抑郁症。巴比妥类药物，可延长老年人中枢抑制作用或出现兴奋激动等，可能由于排泄或代谢功能变化所致，故老年人应慎重使用该类药物。

（2）解热镇痛药：阿司匹林、对乙酰氨基酚等对发热（尤其是高热）的老人，可致大汗淋漓、血压下降、体温下降、四肢冰冷、极度虚弱，甚至虚脱。如用于镇痛长期服用阿司匹林、吲哚美辛等非甾体抗炎药，可致消化道溃疡、胃出血、呕吐咖啡色物及黑粪，尤其对患有心脏病或肾功能损害的老年患者危害更加严重。

（3）心血管系统用药：抗高血压药，如利血平、甲基多巴，长期应用易导致精神忧郁症；血管扩张药、β 受体拮抗药，易引起直立性低血压；硝苯地平可出现面部潮红、心慌、头痛等反应。抗心绞痛药，如硝酸甘油可引起头晕、头胀、心跳加快、面部潮红，诱发或加重青光眼。抗心律失常药，如胺碘酮可出现室性心动过速；美西律可出现眩晕、低血压、手震颤、心动过缓和传导阻滞；普萘洛尔（β 受体拮抗药）可致心动过缓、心脏停搏，还可诱发哮喘，加重心力衰竭。用于慢性心功能不全药物，如强心苷类药物地高辛，可引起室性期前收缩、传导阻滞及低钾血症等洋地黄中毒反应。

（4）利尿药：如呋塞米、氢氯噻嗪可致脱水、低血钾等不良反应。另外，呋塞米和依他尼酸还可致耳毒性（耳鸣、听力减退）、眩晕、恶心、头痛、共济失调。利尿药均可引起高血糖和高尿酸血症，患糖尿病和有痛风病史的老年人更应慎用。

（5）抗凝药：老年人用肝素、华法林易导致出血，应严格控制剂量。用药期间，应密切观察出血迹象并监测出、凝血时间及国际标准化比值。

（6）降糖药：胰岛素、格列齐特等口服降糖药，因老年人肝、肾功能减退而消除减慢，易发生低血糖反应。

（7）抗胆碱药和抗抑郁药：如阿托品、苯海索和抗抑郁药丙米嗪等，可使前列腺增生的老年病人排尿括约肌抑制而导致尿潴留。阿托品还可诱发或加重老年青光眼，甚至可致盲。阿米替林和丙米嗪，对大多数老年人服用后会出现不安、失眠、健忘、激动、定向障碍、妄想等症状，可能与老年人神经系统功能有关，发现后应停药。

（8）抗震颤麻痹药和抗癫痫药：左旋多巴、金刚烷胺等，可使老年期痴呆加重；左旋多巴还可致排尿困难，引起直立性低血压。苯妥英钠，对患有低蛋白血症或肾功能低下的老年患者，可增加神经和血液方面的不良反应，应根据年龄适当减少剂量并监测血药浓度。

（9）抗过敏性药：苯海拉明、氯苯那敏等可致嗜睡、头晕、口干等反应。

（10）抗生素：大量长期应用广谱抗生素，容易出现肠道菌群失调或真菌感染等严重并发症。庆大霉素、卡那霉素等氨基糖苷类与利尿药合用，可加重耳、肾毒性反应。老年人对药物产生的肾毒性比较敏感，使用四环素、万古霉素等应慎重，使用氨基糖苷类、头孢菌素类、多黏菌素，需减量或延长给药时间间隔。

（11）糖皮质激素类药物：如泼尼松、地塞米松等长期应用，可致水肿、高血压、高血糖，易使感染扩散，并可诱发溃疡出血等。

（12）维生素及微量元素：维生素A过量，可引起中毒，表现为畏食、毛发脱落、易发怒激动、骨痛、骨折、颅内压增高（头痛、呕吐等）。维生素E过量会产生严重不良反应，如静脉血栓形成、头痛及腹泻等。微量元素锌过量，可致高脂血症及贫血；硒补过多，可致慢性中毒、引起恶心、呕吐、毛发脱落、指甲异常等。

4．老年人用药注意事项　由于老年人药物的体内过程和药理作用明显不同于年轻人，充分认识其特殊性，从而对老年患者合理用药，提高药物的疗效，减少或避免药品不良反应，这对老年人疾病的防治具有重要意义。

（1）明确用药指征，合理选药：由于老年人生理衰老、病理变化，往往患有多种疾病，用药品种亦较多。因此，在给老年患者用药前，医师应了解其疾病史、用药史及目前用药情况，在此基础上首先做出正确的诊断，明确用药指征，选择疗效确切、不良反应小、无相互作用、能纠正病理过程或消除病因的药物。若无必要用药，则坚决不用；可用可不用药，以不用为好。就是说，对于老年人，除急症或器质性病变外，应尽量少使用药物。当老年患者必须进行药物治疗时，则应用最少的药物和最小的有效剂量，一般不超过3～4种药物配用，以免药物相互作用而产生严重不良反应或拮抗疗效，也免得老年人漏用或误用。

（2）用药剂量个体化：老年人用药应从小剂量开始，逐渐增加至个体最合适的获得满意疗效的治疗剂量。一般来说，应根据年龄、体重、体质情况，以成人用量的1/2、2/3、3/4顺序用药。即使采用此法，也因老年人个体差异很大，而最好是根据药物的药动学特点、监测血药浓度及肝肾功能降低的情况适当调节剂量，实行剂量个体化。如药物或活性代谢产物主要由肾排泄时，给药剂量或给药时间调整，均需根据肌酐清除率、原型药物经肾排泄百分率（F），按下列公式计算剂量调整系数。

剂量调整系数 = $1/F\ (K_f - 1) + 1$

K_f表示肾功能降低或肾病患者的肾排泄功能，即其肌酐清除率除以肌酐清除率正常值（每分钟120 ml）而得。按下列公式计算调整剂量和给药时间间隔，即：

肾功能降低者或肾病患者给药剂量 = 正常人剂量 / 剂量调整系数

肾功能降低者或肾病患者给药时间间隔 = 正常人给药时间间隔 × 剂量调整系数

（3）选择合适的药物剂型，简化用药方法：老年人因体质方面变化，给药方法较年轻人更为重要，只有采取适当的给药方法，才能取得较好的疗效。静脉注射或滴注给药途径不方便，只有吞咽困难或重病人采用。一般多采用口服给药，许多老年人吞咽片剂或胶囊困难，尤其量较大时，故宜选用颗粒剂、口服液或喷雾剂。由于老年人胃肠功能减退和不稳定，将影响缓

释、控释药物制剂的释放，如胃排空及肠道运动减慢，使其释放增加，提高吸收量而产生不良反应。故也不宜使用缓、控释药物制剂。

选用简便的服用方法对老年人更有益，免得漏服。有明确适应证的药物，尽量选用一天用药 1 ~ 2 次的药物。需要特别注意的是，尽量不用服药间隔不规则的药物，以便提高依从性。

(4) 密切观察临床可能出现的药品不良反应：注意观察患者的临床表现，并定期测定其肝肾功能、血象、电解质和酸碱情况，在用药过程中一旦出现不良反应，应及时停药，并采取相应措施，对原有疾病更换作用相同或相似的、不良反应小的药物进行治疗。

5. 让患者或家属清楚掌握用药　为老年患者开的处方，医师的字迹更要清楚，诸项完整明确，患者或家属一目了然。药师在发药时，对药物的用法、用量及注意事项要耐心交待清楚。在有条件情况下，要给患者用药指导卡片，其内容：①老年患者用药注意事项；②忠告患者合理营养，加强身体锻炼，保持身心健康，不可滥用滋补药、保健品、抗衰老药；③写明本次所取诸药的用法、用量及注意事项；④药品特殊保存方法。

四、妊娠与哺乳期妇女用药

（一）妊娠期妇女用药

妇女的妊娠期分为 4 个时期，第 1 期为着床前期，从受精到着床约 12 日。第 2 期为器官形成期（妊早期），从 13 ~ 56 日。第 3 期占其余 70% 的妊娠期（妊中期），是生长发育期。第 4 期是分娩期（妊晚期），为 7 ~ 14 日。妊娠妇女的用药、剂量和作用时间、胎儿的遗传构成和易感性、母亲的年龄及营养状况等诸多因素均决定药物对胎儿的影响。尤其是前 2、3 期最危险。

妊娠期妇女用药直接关系到下一代的身心健康。在胎儿发育过程中的不同阶段，其器官功能和药物代谢酶系统尚不完善，如用药不当，就会产生不良影响。因此，为防止诱发畸胎、器官损伤，在妊娠初始的第 2、3 期内应尽量避免用药，尤其是已确定或怀疑有致畸作用的药物。如必须用药，应在医、药师的指导下，选用一些无致畸作用的药物。对致畸性尚未充分了解的新药，一般避免使用。

国外把对妊娠有危险性的药物分成 5 个等级（即 A、B、C、D、X 级），由美国 FDA 颁布，大部分药物危害性的级别均由制药公司按上述标准拟定，详情可检索《新编药物学》第 16 版附录 5（危险等级的药物检索表）。妊娠期妇女禁用的药物名单，见总表 -4。

总表 -4　妊娠期妇女禁用的药物名单

类　别	药　　物
抗感染药物	链霉素、盐酸大观霉素、依托红霉素、琥乙红霉素、氯霉素（妊晚期禁用）、米诺环素、多西环素、喹诺酮类抗菌药、磺胺嘧啶（临近分娩禁用）、磺胺甲噁唑（临近分娩禁用）、磺胺异噁唑（临近分娩禁用）、甲硝唑（初始 3 个月禁用）、呋喃唑酮、利福平（初始 3 个月禁用）、伊曲康唑、阿糖腺苷、利巴韦林、伐昔洛韦、膦甲酸钠、阿巴卡韦、依非韦伦、甲苯咪唑、盐酸左旋咪唑、甲苯咪唑、阿苯达唑、噻苯唑、噻嘧啶、乙胺嘧啶、沙利度胺、司他夫定、奎宁、磷酸氯喹、喷他咪
主要作用于精神和神经系统药物	左旋多巴、溴隐亭（妊早期禁用）、卡马西平、苯妥英钠、磷苯妥英钠、三甲双酮（妊早期）、扑米酮、夸西泮、咪达唑仑、苯巴比妥、异戊巴比妥、水合氯醛、地西泮（初始 3 个月禁用）、奥沙西泮、氟西泮、氯硝西泮、三唑仑、艾司唑仑、扎来普隆、赖氨酸阿司匹林（妊晚期禁用）、贝诺酯、双水杨酸酯、尼美舒利、萘普生、双氯芬酸钠（初始 3 个月禁用）、舒林酸、吡罗昔康（妊晚期禁用）、美罗昔康、氯诺昔康、萘丁美酮（妊晚期禁用）、

（续 表）

类 别	药 物
	依托度酸、尼美舒利、塞来昔布、帕瑞昔布、伐地昔布、金诺芬、阿明诺芬、奥沙普嗪、芬布芬、洛索洛芬、甲芬那酸、甲氯芬那酸、吲哚美辛、青霉胺、柳氮磺吡啶、秋水仙碱、别嘌醇、麦角胺、丁丙诺啡、戊四氮、贝美格、吡拉西坦、他克林、左旋多巴、苯噻啶、阿米替林、盐酸丙米嗪、氟西汀、盐酸哌替啶（临近分娩禁用）、盐酸美沙酮、盐酸硫吡醇、甲磺酸双麦角碱、利扎曲普坦、洛美利嗪、罗匹尼罗、齐拉西酮、左乙拉西坦、多奈哌齐
麻醉药与主要作用于骨骼肌系统药物	咪达唑仑（初始3个月禁用）、氯化筒箭毒碱（妊娠前3个月禁用）、顺阿曲库铵、利鲁唑
主要作用于循环系统药物	伊布曲特、地尔硫䓬（注射剂禁用）、卡维地洛、美托洛尔（中晚期禁用）、索他洛尔（中晚期禁用）、比索洛尔、阿罗洛尔、丁咯地尔、阿托伐他汀、洛伐他汀、普伐他汀、氟伐他汀、匹伐他汀、非诺贝特、辛伐他汀、阿西莫司、氯贝丁酯、非诺贝特、普萘洛尔（中晚期禁用）、吲哒帕胺（妊娠高血压者禁用）、尼索地平、尼群地平、非洛地平、马尼地平、阿折地平、赖诺普利（中晚期禁用）、卡托普利、依那普利、咪达普利、贝那普利、培哚普利、福辛普利、西拉普利、雷米普利、喹那普利、咪达普利、佐芬普利、氯沙坦（中晚期禁用）、缬沙坦、厄贝沙坦（中晚期禁用）、替米沙坦、奥美沙坦酯、坎地沙坦西酯、依普罗沙坦、特拉唑嗪、肼屈嗪、盐酸乌拉地尔、利血平、曲匹地尔（初始3个月禁用）、盐酸米多君、前列地尔
主要作用于呼吸系统药物	氢溴酸右美沙芬（初始3个月禁用）、厄多司坦、喷托维林、氯哌斯汀、非诺特罗、曲尼司特、异丙托溴铵（妊早期禁用）、噻托溴铵（临近分娩禁用）、波生坦
主要作用于消化系统药物	曲硫嗪、哌仑西平、枸橼酸铋钾、胶体果胶铋、碱式碳酸铋、胶体酒石酸铋、西咪替丁、雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁、枸橼酸铋雷尼替丁、米索前列醇、罗沙前列醇、恩前列素、甘珀酸钠、吉法酯、醋氨乙酸锌（初始3个月禁用）、泮托拉唑（初始3个月禁用）、雷贝拉唑钠、埃索美拉唑、西沙必利、奥沙普嗪、奥柳氮钠、复方铝酸铋、匹维溴铵、马来酸曲美布汀、多拉司琼、托烷司琼、雷莫司琼、硫酸镁、甲氧氯普胺、硫酸钠、蓖麻油、欧车前亲水胶、苦参素、苯乙哌啶、复方樟脑酊、硫普罗宁、甘草酸二胺、甲磺酸加贝酯、乙型肝炎疫苗注射剂、非布丙醇、曲匹布通、羧甲香豆素、熊去氧胆酸、鹅去氧胆酸、盐酸西布曲明、奥曲肽、阿糖腺苷、柳氮磺吡啶（临近分娩禁用）、特利加压素、醋酸兰瑞肽、生长抑素、鞣酸加压素、三甘氨酰基赖氨酸加压素
主要作用于泌尿和生殖系统药物	布美他尼（初始3个月禁用）、醋甲唑胺、醋羟胺酸、鞣酸加压素、垂体后叶素、缩宫素、麦角胺、麦角新碱（胎盘娩出前禁用）、马来酸麦角新碱（胎盘未剥离胎儿娩出前）、地诺前列酮（胎位异常者禁用）、呋塞米、布美他尼（初始3个月禁用）、氟他胺、比卡鲁胺、非那雄胺、依立雄胺、度他雄胺
主要作用于血液和造血系统药物	促红素、血凝酶、依诺肝素（妊娠早期禁用）、达肝素（妊娠早期禁用）、华法林钠、双香豆素、双香豆素乙酯、醋硝香豆素、茴茚二酮、苯茚二酮、降纤酶、去纤酶、重组人组织型纤溶酶原激酶衍生物、莫拉司亭、培非格司亭、阿法达贝泊汀、羟乙基淀粉（妊娠早期禁用）、西洛他唑、沙格雷酯、伊洛前列素

（续　表）

类　别	药　　物
主要作用于内分泌和代谢系统药物	甲磺酸溴隐亭、兰瑞肽、重组促卵泡激素 α、重组促卵泡激素 β、西曲瑞克、曲安奈德、雌二醇、戊酸雌二醇、炔雌醇、雌三醇、尼尔雌醇、己烯雌酚、尿促性素、氯米芬、亮丙瑞林、曲普瑞林、甲睾酮（妊早期禁用）、苯丙酸诺龙、甲地孕酮、左炔诺孕酮、孕三烯酮、氯地孕酮、羟孕酮、米非司酮、卡前列素、卡前列甲酯、甲苯磺丁脲、格列本脲、格列吡嗪、格列齐特、格列喹酮、格列美脲、苯乙双胍、二甲双胍、罗格列酮、吡格列酮、瑞格列奈、那格列奈、降钙素、碘化钾、重组人生长激素、雷洛昔芬、羟乙膦酸钠、帕米膦酸二钠、依替膦酸二钠、氯屈磷酸二钠、阿仑膦酸钠、伊班膦酸钠、替鲁膦酸钠、利塞膦酸钠
维生素、营养与调节水、电解质和酸碱平衡药物	过量维生素 D、过量维生素 A、葡萄糖酸锌
抗变态反应药及免疫调节药物	苯海拉明（妊早期禁用）、茶苯海明（妊早期妊晚期）、西替利嗪（妊早期禁用）、左西替利嗪、异丙嗪（临近分娩禁用）、依巴斯汀、司他斯汀、左卡巴斯汀、曲尼司特、青霉胺、环孢素、他克莫司、硫唑嘌呤、咪唑立宾、匹多莫德（初始 3 个月禁用）、来那度胺、抗人淋巴细胞免疫球蛋白、来氟咪特、吗替麦考酚酯、干扰素、重组人白细胞介素 Ⅱ、雷公藤多苷
皮肤与软组织用药	鬼臼毒素、林旦、维胺酯、维 A 酸、阿达帕林、异维 A 酸、他扎罗汀、甲氧沙林、三甲沙林
抗肿瘤药物	氮芥、苯丁酸氮芥、硝卡芥、美法仑、氧氮芥、甲氧芳芥、环磷酰胺、异环磷酰胺、甘磷酰芥、嘧啶亚硝脲、氮甲、白消安、六甲蜜胺、雌莫司汀、卡莫司汀、洛莫司汀、司莫司汀、尼莫司汀、福莫司汀、塞替派、达卡巴嗪、卡培他滨、甲氨蝶呤、氨蝶呤、巯嘌呤（初始 3 个月禁用）、硫鸟嘌呤（初始 3 个月禁用）、硫唑嘌呤、氟尿嘧啶（初始 3 个月禁用）、氟尿苷、卡莫氟、去氧氟尿苷、氟尿脱氧核苷、替加氟（初始 3 个月禁用）、羟基脲、美法仑、阿糖胞苷（初始 3 个月禁用）、吉西他滨、苏尼替尼、丝裂霉素（初始 3 个月禁用）、平阳霉素、柔红霉素、多柔比星（初始 3 个月禁用）、吡柔比星、表柔比星、阿柔比星、伊达比星、长春碱、长春新碱、长春地辛、长春瑞滨、依托泊苷、替尼泊苷、拓扑替康、伊立替康、紫杉醇、多西他赛、羟喜树碱、高三尖衫酯碱、门冬酰胺酶（初始 3 个月禁用）、顺铂、卡铂、奥沙利铂、赛特铂、米托蒽醌、他莫昔芬、托瑞米芬、福美坦、依西美坦、氨鲁米特、来曲唑、阿那曲唑、甲羟孕酮、甲地孕酮、亮丙瑞林、戈舍瑞林、戈那瑞林、阿拉瑞林、曲普瑞林、丙卡巴肼、达卡巴嗪、亮脯利特、三氧化二砷、靛玉红、托烷司琼、利妥昔单抗、群司珠单抗、泊特佐米单抗、氟维司群、替莫唑胺、雷替曲塞、氟尿嘧啶、喜树碱
生物制品	森林脑炎灭活疫苗、冻干黄热病活疫苗、冻干流行性腮腺炎活疫苗、流行性出血热灭活疫苗（Ⅰ型、Ⅱ型）、水痘减毒活疫苗、冻干风疹活疫苗、斑疹伤寒疫苗、霍乱疫苗、甲型肝炎活疫苗、伤寒菌苗、伤寒副伤寒甲、乙菌苗、伤寒Ⅵ多糖菌苗、钩端螺旋体菌苗、冻干鼠疫活菌苗、冻干人用布氏菌病活菌苗、霍乱菌苗、乙型肝炎疫苗

依据《中华人民共和国药典临床用药须知》2005 年版整理

总论

（二）哺乳期妇女用药

药物由母体血浆通过血浆－乳汁屏障进入乳汁中，而后经婴儿通过吞吸后在消化道吸收。乳母用药后药物进入乳汁，其中的含量很少超过母亲摄入量的 1% ~ 2%，故一般不至于给哺乳儿带来危害，然而少数药物在乳汁中的排泄量较大，母亲服用量应考虑对哺乳婴儿的危害，避免滥用。一般药物的分子量＜ 200 和在脂肪与水中都能有一定的溶解度的物质较易通过细胞膜。在药物与母体血浆蛋白结合能力方面，只有在母体血浆中处于游离状态的药物才能进入乳汁，而与母体血浆蛋白结合牢固的药物如抗凝药华法林不会在乳汁中出现。另外，要考虑药物的解离度，解离度越低，乳汁中药物浓度也越低。弱碱性药物（如红霉素）易于在乳汁中排泄，而弱酸性药物（如青霉素）较难排泄。哺乳期妇女用药的原则有：尽量减少药对子代的影响，同时，由于人乳是持续地分泌并在体内不潴留，母亲如须服药，要在服药后第 6 个小时（一般药物的 1 个血浆半衰期）再哺乳，如药品对孩子影响太大则停止哺乳，暂时由人工喂养替代。哺乳期妇女禁用的药物名单，见总表 -5。

总表 -5 哺乳期妇女禁用的药物名单

类 别	药 物
抗感染药物	链霉素、硫酸巴龙霉素、卡那霉素、氯霉素、林可霉素、红霉素、琥乙红霉素、四环素、米诺环素、多西环素、盐酸林可霉素、万古霉素、去甲万古霉素、喹诺酮类抗菌药、磺胺嘧啶、柳氮磺吡啶、磺胺甲噁唑、磺胺异噁唑、呋喃坦啶、特比萘芬、伊曲康唑、两性霉素 B、氯法齐明、利巴韦林、膦甲酸钠、去羟肌苷、阿巴卡韦、依非韦伦、齐多夫定、甲苯咪唑、阿苯达唑、噻苯唑、替硝唑、乙胺嘧啶、伯氨喹、喷他咪、吡喹酮、盐酸左旋咪唑
主要作用于精神和神经系统药物	左旋多巴、金刚烷胺、卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠、磷苯妥英钠、唑吡坦、碳酸锂、甲喹酮、地西泮、硝西泮、奥沙西泮、氟硝西泮、三唑仑、水合氯醛、扎来普隆、扑米酮、利培酮、奥氮平、氟哌利多、甲丙氨酯、盐酸氯丙嗪、氟哌啶醇、氯普噻吨、舒必利、氟伏沙明、齐拉西酮、赖氨酸阿司匹林、对乙酰氨基酚、贝诺酯、双水杨酸酯、可待因、尼美舒利、双氯芬酸钠／米索前列醇、萘普生、吲哚美辛、舒林酸、芬布芬、金诺芬、洛索洛芬、吡罗昔康、美罗昔康、氯诺昔康、萘丁美酮、依托度酸、塞来昔布、奥沙普嗪、青霉胺、柳氮磺吡啶、秋水仙碱、别嘌醇、麦角胺、羟考酮、丁丙诺啡、吗啡、戊四氮、贝美格、士的宁、吡拉西坦、他克林、氟西汀、帕罗西汀、西酞普兰、舍曲林、氟扶沙明、草酸 S- 西酞普兰、文拉法辛、盐酸多奈哌齐、托卡朋
主要作用于循环系统药物	伊布曲特、地尔硫䓬、卡维地洛、比索洛尔、阿罗洛尔、丁咯地尔、氟桂利嗪、马尼地平、阿托伐他汀、洛伐他汀、普伐他汀、非诺贝特、辛伐他汀、匹伐他汀、氯贝丁酯、阿西莫司、非诺贝特、依那普利、贝那普利、赖诺普利、雷米普利、培哚普利、福辛普利、西拉普利、佐芬普利、厄贝沙坦、替米沙坦、奥美沙坦酯、坎地沙坦西酯、依普罗沙坦、特拉唑嗪、盐酸乌拉地尔、盐酸肼屈嗪、二氮嗪、盐酸米多君
主要作用于呼吸系统药物	厄多司坦、喷托维林、氯哌斯汀、右美沙芬、倍氯米松
主要作用于消化系统药物	西咪替丁、雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁、罗沙替丁乙酸酯、雷尼替丁枸橼酸铋、泮托拉唑、埃索美拉唑、雷贝拉唑钠、胶体酒石酸铋、米索前列醇、罗沙前列醇、恩前列素、甘珀酸钠、马来酸曲美布汀、瑞巴

（续 表）

类 别	药 物
	派特、复方铝酸铋、匹维溴铵、雷莫司琼、托烷司琼、多拉司琼、西沙必利、依托必利、酚酞、欧车前亲水胶、地芬诺酯、次水杨酸铋、复方樟脑酊、马洛替酯、硫普罗宁、熊去氧胆酸、非布丙醇、奥利司他、乌司他丁、柳氮磺吡啶、醋酸兰瑞肽、甲磺酸萘莫司他、生长抑素、奥曲肽
主要作用于泌尿和生殖系统药物	环噻嗪、苯噻嗪、泊利噻嗪、贝美噻嗪、乙酰唑胺、醋甲唑胺、黄酮哌酯
主要作用于血液和造血系统药物	双香豆素乙酯、茴茚二酮、苯茚二酮、依诺肝素、达肝素、降纤酶、去纤酶、前列地尔、非格司亭、莫拉司亭、培非格司亭、西洛他唑、伊洛前列素、阿法达贝泊汀
主要作用于内分泌和代谢系统药物	甲磺酸溴隐亭、麦角胺、兰瑞肽、西曲瑞克、曲安奈德、雌二醇、戊酸雌二醇、炔雌醇、雌三醇、尼尔雌醇、己烯雌酚、亮丙瑞林、炔诺酮、甲地孕酮、左炔诺孕酮、孕三烯酮、氯地孕酮、羟孕酮、米非司酮、卡前列素、卡前列甲酯、甲苯磺丁脲、格列本脲、苯乙双胍、二甲双胍、罗格列酮、吡格列酮、瑞格列奈、那格列奈、降钙素、卡比马唑、甲硫氧嘧啶、碘化钾、阿仑膦酸钠、伊班膦酸钠、利塞膦酸钠
抗变态反应药及免疫调节药物	苯海拉明、左西替利嗪、依巴斯汀、司他斯汀、曲普利啶、青霉胺、环孢素、他克莫司、麦考酚吗乙酯、硫唑嘌呤、咪唑立宾、匹多莫德、来那度胺、抗人淋巴细胞免疫球蛋白、来氟米特、雷公藤多苷、干扰素
皮肤与软组织用药	鬼臼毒素、林旦、茶苯海明、异维A酸、他扎罗汀
抗肿瘤药物	氮芥、苯丁酸氮芥、硝卡芥、美法仑、氧氮芥、环磷酰胺、异环磷酰胺、六甲蜜胺、甘磷酰芥、嘧啶亚硝脲、雌莫司汀、卡莫司汀、洛莫司汀、尼莫司汀、福莫司汀、白消安、噻替派、甲氨蝶呤、硫唑嘌呤、氟尿嘧啶、氟尿苷、卡莫氟、替加氟、去氧氟尿苷、氟尿脱氧核苷、阿糖胞苷、丝裂霉素、平阳霉素、柔红霉素、吡柔比星、多柔比星、阿柔比星、伊达比星、吉西他滨、长春地辛、长春瑞滨、卡培他滨、依托泊苷、替尼泊苷、羟喜树碱、拓扑替康、伊立替康、紫杉醇、多西他赛、高三尖衫酯碱、顺铂、卡铂、奥沙利铂、他莫昔芬、托瑞米芬、福美坦、依西美坦、氨鲁米特、来曲唑、阿那曲唑、甲羟孕酮、甲地孕酮、亮丙瑞林、戈舍瑞林、戈那瑞林、阿拉瑞林、曲普瑞林、丙卡巴肼、达卡巴嗪、米托蒽醌、羟基脲、来曲唑、阿那曲唑、利妥昔单抗、曲妥珠单抗、群司珠单抗、泊特佐米单抗、替莫唑胺、雷替曲塞、门冬酰胺酶、靛玉红、喜树碱
生物制品	森林脑炎灭活疫苗、流行性出血热灭活疫苗、斑疹伤寒疫苗、霍乱疫苗、伤寒菌苗、伤寒副伤寒甲菌苗、伤寒VI多糖菌苗、钩端螺旋体菌苗、冻干鼠疫活菌苗、冻干人用布氏菌病活菌苗
维生素、营养与调节水、电解质和酸碱平衡药物	葡萄糖酸锌
对比剂	碘泛酸、碘阿芬酸、碘普罗胺

依据《中华人民共和国药典临床用药须知》2005年版整理

五、肝、肾功能不全的患者用药

（一）肝功能不全的患者用药

肝脏是人体内最大的实质性腺体，具有十分重要的生理功能，首先是人体各种物质代谢和加工的中枢，并把多余的物质（如糖、蛋白质、脂肪）加以储存；其次，肝脏还有生物转化和解毒功能，对绝大部分进入人体的药物和毒物，都会在肝脏发生氧化、还原、水解、结合等化学反应，不同程度地被代谢，最后以代谢物的形式排出体外。由于肝细胞不断地从血液中吸取原料，难以避免遭受有毒物质或病毒、毒素、药物和寄生虫的感染或损害，轻者丧失一定的功能，重者造成肝细胞坏死，最后发展为肝硬化、肝癌及肝衰竭，甚至发生肝性脑病。

另外，肝脏又是许多药物代谢的主要场所，当肝功能不全时，药物代谢必然受到影响，药物生物转化减慢，血浆中游离型药物增多，从而影响药物的效应并增加毒性。因此必须减少用药剂量或用药次数，特别是给予有肝毒性的药物时更需谨慎，见总表 -6。

总表 -6 肝功能不全患者慎用药物名单

损害类别	影 响 药 物
代谢性药肝	氯丙嗪、三环类抗抑郁药、抗癫痫药、抗风湿药、抗甲状腺药、免疫抑制药、口服避孕药、甲睾酮和其他蛋白同化激素、巴比妥类、甲基多巴
急性实质性药肝	
剂量依赖性肝细胞坏死	对乙酰氨基酚
非剂量依赖性肝细胞坏死	异烟肼、对氨水杨酸、氟烷、三环类抗抑郁药、单胺氧化酶抑制药、抗癫痫药、肌松药、抗溃疡药、青霉素衍生物、抗真菌药、利尿药、美托洛尔、钙通道阻滞药、奎尼丁、鹅去氧胆酸、可卡因
药物引起的脂肪肝	
以胆汁淤积性损害为主	异烟肼、甲氨蝶呤、苯妥英钠、苯巴比妥、糖皮质激素、四环素、水杨酸类、丙戊酸钠
肝肉芽肿浸润	异烟肼、硝基呋喃类、青霉素衍生物、磺胺类、抗癫痫药、阿司匹林、金盐、别嘌醇、保泰松、雷尼替丁、氯磺丙脲、氯丙嗪、奎尼丁、地尔硫䓬、丙吡胺、肼屈嗪
慢性实质性药肝	
活动性慢性肝炎	甲基多巴、呋喃妥因、丹曲林、异烟肼、氯美辛、对乙酰氨基酚
慢性胆汁淤积	氯丙嗪、丙米嗪、甲苯磺丁脲、红霉素、噻苯达唑、丙戊酸钠、非诺洛芬
肝纤维化和肝硬化	甲氨蝶呤、烟酸、维生素 A
肝磷脂和酒精性肝炎样	胺碘酮
药物引起的胆管病变（硬化性胆管炎）	氟尿嘧啶
药物引起的肝血管病变	
布卡综合征	口服避孕药、达卡巴嗪
静脉栓塞性疾病	硫唑嘌呤、噻苯达唑、硫鸟嘌呤、环磷酰胺、环孢素、多柔比星、丝裂霉素、卡莫司汀、雌激素
肝窦状隙损害，包括扩张、紫癜肝、周边窦状隙纤维化、非硬化性门静脉高压、小节再生性增生、肝动脉和门静脉血栓	硫唑嘌呤、口服避孕药、雄激素、同化激素、维生素 A、甲氨蝶呤、巯嘌呤

总
论

（续 表）

损害类别	影响药物
肝脏肿瘤	
良性肿瘤	口服避孕药、雄激素和蛋白同化激素
病灶性小节增生	口服避孕药
肝细胞癌	口服避孕药、雄激素和蛋白同化激素
ALT 和 AST 升高	四环素、林可霉素、克林霉素、两性霉素 B、氨苄西林、羧苄西林、苯唑西林、氯唑西林、美洛西林、多黏菌素、头孢呋辛、头孢美唑、头孢曲松、头孢哌酮、头孢他啶、拉氧头孢、头孢地嗪、亚胺培南／西司他丁钠等；红霉素酯化物、依托红霉素、氟康唑、伊曲康唑、灰黄霉素、酮康唑、阿昔洛韦、伐昔洛韦、泛昔洛韦、异烟肼、利福平、乙胺丁醇、辛伐他汀、普伐他汀、洛伐他汀、氟伐他汀、阿托伐他汀、来氟米特、吗替麦考酚酯、咪唑立宾、匹莫林、莫雷西嗪、西咪替丁、罗沙替丁、尼扎替丁、奥美拉唑、兰索拉唑、雷贝拉唑、肝素钙、依诺肝素、达肝素钠、那屈肝素钙、降纤酶、东菱精纯抗栓酶、氯丙嗪、氟哌啶醇、氯普噻吨、奥氮平
血清-谷氨酰转移酶（γ-GT）升高	苯妥英钠、苯巴比妥、乙醇

1．肝功能不全患者的用药原则

（1）明确诊断，合理选药。

（2）避免或减少使用对肝脏毒性较大的药物。

（3）注意药物相互作用，特别应避免肝毒性的药物合用。

（4）对肝功能不全而肾功能正常的患者可选用对肝功能毒性小，并且从肾脏排泄的药物。

（5）开始用药时宜小剂量，必要时进行血药浓度监测，做到给药方案个体化。

（6）定期检查肝功能，及时调整治疗方案。

2．肝功能不全患者抗菌药物的选择

（1）可按常量应用的药物：青霉素、头孢唑啉、头孢他啶、氨基糖苷类、万古霉素类和多黏菌素类、氧氟沙星、环丙沙星等氟喹诺酮类。

（2）对严重肝病者需减量使用的药物（对一般肝病者可按常量应用）：哌拉西林、美洛西林、阿洛西林、羧苄西林、头孢噻肟、头孢曲松、头孢哌酮、红霉素、克林霉素、甲硝唑、氟罗沙星、氟胞嘧啶、伊曲康唑等。

（3）肝病者减量用药：林可霉素、培氟沙星、异烟肼（异烟肼在肝炎活动期避免使用）。

（4）肝病者避免使用的药物：红霉素酯化物、四环素类、氯霉素、利福平类、两性霉素 B、酮康唑、咪康唑、特比萘芬、磺胺类。

（二）肾功能不全的患者用药

肾脏是药物排泄的主要器官，也是药物代谢的器官之一，极易受到某些药物的作用而出现毒性反应。肾毒性的表现有轻度的肾小球、肾小管损伤，肾衰竭，临床可见蛋白尿、管型尿、血肌酐、尿素氮值升高，严重时可引起少尿、无尿或肾衰竭。磺胺药除引起血尿外，还可发生结晶尿。肾功能受损时，药物吸收、分布、代谢、排泄以及机体对药物的敏感性均可能发生改变。

1．肾功能不全时药动学和药效学特点

（1）吸收：肾功能不全患者肾单位数量减少、肾小管酸中毒。如维生素 D 羟化不足，可导致肠道钙吸收减少。慢性尿毒症患者常伴有胃肠功能紊乱，如腹泻、呕吐，这些均减少药物的吸收。

（2）分布：肾功能损害能改变药物与血浆蛋白的结合率。一般而言，酸性药物

血浆蛋白结合率下降。如苯妥英钠、呋塞米，而碱性药物血浆蛋白结合率不变（普萘洛尔、筒箭毒碱）或减低（地西泮、吗啡）。其作用机制为：①血浆蛋白含量下降；②酸性代谢产物蓄积，竞争血清蛋白，使药物蛋白结合率下降；③血浆蛋白结构或构型改变，导致药物与蛋白结合点减少或亲和力下降。

肾功能不全，血浆蛋白结合率改变，药物分布容积也可改变。大多数药物表现为分布容积增加，某些蛋白结合率低的药物，如庆大霉素、异烟肼等分布容积无改变。例外的是，地高辛分布容积减少。

肾功能不全所致药物蛋白结合率及分布容积改变的临床意义很难预测。一方面，药物蛋白结合率下降，游离血药浓度增高，作用增强，毒性增加，但另一方面，分布容积增加，消除加快，半衰期缩短。

（3）代谢：肾脏含有多种药物代谢酶，氧化、还原、水解及结合反应在肾脏均可发生，所以有肾脏疾病时，经肾脏代谢的药物生物转化障碍。如尿毒症患者维生素D_3的第二次羟化障碍。

由于肾功能受损，药物的代谢也可能发生改变。如药物的氧化反应加速，还原和水解反应减慢，对药物的结合反应影响不大。肾功能损害患者对苯妥英钠、苯巴比妥和普萘洛尔的排泄均较正常人快。

（4）排泄：肾功能损害时，主要经肾脏排泄的药物消除减慢，血浆半衰期延长。因药物在体内蓄积作用加强，甚至产生毒性反应，其作用机制如下。

①肾小球滤过减少。如地高辛、普鲁卡因胺、氨基糖苷类抗感染药物都主要经肾小球滤过而排出体外。急性肾小球肾炎及严重肾缺血患者，肾小球滤过率下降，上述药物排泄减慢。

②肾小管分泌减少。尿毒症患者体内蓄积的内源性有机酸可与弱酸性药物在转运上发生竞争使药物经肾小管分泌减少。轻、中度肾衰竭时，这种竞争所致的有机酸排出减少可能比功能性肾单位减少更重要。

③肾小管重吸收增加。肾功能不全患者体内酸性产物增加，尿液pH下降，弱酸性药物离子化减少，重吸收增加。

④肾血流量减少。某些疾病，如休克、心力衰竭、严重烧伤均可致肾血流量减少。由于肾血流量减少，肾小球滤过、肾小管分泌、重吸收功能均可能发生障碍，从而导致肾药物排泄减少。

某些药物在体内的代谢产物仍有药理活性，甚至毒性，肾功能受损时，这些代谢产物在体内蓄积产生不良反应。其中最典型的是普鲁卡因胺，其代谢产物N-乙酰卡尼（NAPA）85%经肾排泄。肾功能不全患者半衰期从正常人的6小时延长到45小时。美托洛尔肾排泄其代谢产物去甲基美托洛尔仅为5%～10%，当肾功能不全时其半衰期为正常受试者的4～6倍。在肾功能不全时，抗生素不能及时排出，在血和组织内发生积蓄，更易出现毒性反应。

（5）肾功能不全者机体对药物的敏感性改变：镇静、催眠药对慢性尿毒症患者的中枢抑制作用明显增强，肾功能不全患者对甲基多巴的降压作用更敏感。但进一步研究发现这些现象的产生是由于肾功能损害导致血－脑屏障功能受损，进入中枢神经的药量增加所致，而不是真正的机体敏感性改变。

尿毒症患者常伴有电解质及酸碱平衡紊乱。如低血钾可降低心脏传导性，因而增加洋地黄类、奎尼丁、普鲁卡因胺等药物的心脏传导抑制作用；酸血症和肾小管酸中毒可对抗儿茶酚胺的升压作用。这些现象是敏感性发生改变的典型例子。

无论是药物分布的改变，还是机体敏感性的改变，肾功能损害时机体对药物的反应性均可能发生改变。因此，临床应用时应予以考虑。

2．肾功能不全患者用药原则

（1）明确诊断，合理选药。

（2）避免或减少使用对肾脏毒性大的药物。

（3）注意药物相互作用，特别应避免与有肾毒性的药物合用。

（4）肾功能不全而肝功能正常者可选用具有双通道排泄的药物。

（5）必要时进行血药浓度监测，设计个体化给药方案。

（6）定期检查肾功能，依据肾小球滤

过率、肌酐清除率及时调整治疗方案和药物剂量。

3．肾功能不全患者抗菌药物的选择

（1）可按正常剂量略减剂量使用的抗菌药物：阿莫西林、氨苄西林、美洛西林、哌拉西林、头孢噻肟、头孢哌酮、头孢曲松、红霉素、螺旋霉素、吉他霉素、氯霉素、磷霉素、多西环素、林可霉素类、利福霉素类、环丙沙星、甲硝唑、酮康唑、异烟肼、乙胺丁醇。

（2）可按正常剂量减半使用的抗菌药物：青霉素、阿洛西林、羧苄西林、头孢噻吩、头孢氯苄、头孢唑啉、头孢拉定、头孢孟多、头孢呋辛、头孢西丁、头孢他啶、头孢唑肟、头孢吡肟、拉氧头孢、氨曲南、亚胺培南、氧氟沙星、磺胺甲噁唑、甲氧苄啶。

（3）避免应用，确有指征应用时在血药浓度监测下并显著减量使用的药物：庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、阿米卡星、奈替米星、链霉素、万古霉素、两性霉素 B、替考拉宁、氟尿嘧啶。

（4）禁用的药物：四环素类（多西环素除外）、呋喃妥因、萘啶酸、特比萘芬等。四环素、土霉素的应用可加重氮质血症，硝基呋喃类和萘啶酸可在体内明显积聚，产生对神经系统的毒性反应。故均不宜应用，可选用其他抗菌活性相仿、毒性低的药物替代。肾病患者慎用的药物，见总表 -7。

总表 -7　肾病患者慎用的药物

损害类别	影响药物
肾小球功能障碍	非甾体抗炎药、硝普钠、四环素类抗生素、普萘洛尔、可乐定、利血平、米诺地尔、甲基多巴、哌唑嗪、尼卡地平、卡托普利、硝苯地平、两性霉素 B、环孢素
肾小管功能障碍	巯嘌呤、锂制剂、格列本脲、四环素类、两性霉素 B、秋水仙碱、利福平、长春新碱等
肾小球肾炎及肾病综合征	金制剂、锂制剂、铋制剂、青霉胺、丙磺舒、卡托普利、非甾体抗炎药、氯磺丙脲、利福平、甲巯咪唑、华法林、可乐定、干扰素、磺胺类
急性肾衰竭	
泌尿系统阻塞	镇静催眠药、阿片制药、抗抑郁药、溴苄胺、甲基麦角丁胺、麦角衍生物、甲基多巴、解热镇痛药、吗啡及海洛因等镇痛剂、抗凝药、磺胺类、甲氨蝶呤、巴比妥类、乙醇、利福平、氯琥珀胆碱、巯嘌呤及对比剂等
血管阻塞	氨基己酸、噻嗪类利尿药、磺胺类、糖皮质激素、青霉素、肼屈嗪、普鲁卡因胺、奎尼丁、丙硫氧嘧啶等
肾间质及肾小管损害	头孢噻吩及青霉素类、四环素类、氨基糖苷类抗生素、利福平、磺胺类、非那宗、环孢素、多黏菌素 B、四氯化碳、四氯乙烯、对比剂、右旋糖酐 -40
肾前尿毒症	锂盐、强利尿药、四环素类
急性肾小管坏死	氨基糖苷类抗生素、鱼精蛋白、地尔硫䓬、氢化可的松、卡托普利（低钾及血容量降低可加重毒性）、顺铂等、卡莫司汀、洛莫司汀、甲氨蝶呤、门冬酰胺酶、丝裂霉素、普卡霉素及重金属盐类。能增大上述各药毒性的有呋塞米、甲氧氟烷、两性霉素 B、克林霉素、头孢菌素类及对比剂
渗透性肾病	甘露醇、右旋糖酐 -40、甘油及大量葡萄糖
肾小管损害	头孢菌素、丝裂霉素、口服避孕药、甲硝唑（儿童）、磺胺类、噻嗪类利尿药、别嘌醇、卡马西平、格列本脲、苯妥英钠、奎尼丁、青霉胺、链激酶、苯丙胺、吡罗昔康及生物制品等
急性肾小球肾炎	利福平、肼屈嗪、青霉胺、依那普利等

（续 表）

损害类别	影响药物
间质性肾炎	头孢菌素、青霉素类、庆大霉素、对氨水杨酸、利福平、异烟肼、乙胺丁醇、多黏菌素 B、黏菌素、呋喃妥因、多西环素、磺胺类、氢氯噻嗪、呋塞米、阿米洛利、丙磺舒、吡罗昔康、布洛芬、吲哚美辛、托美丁、舒林酸、阿司匹林、甲氯芬那酸、非那西丁、非诺洛芬及保泰松等、西咪替丁、硫唑嘌呤、环孢素、干扰素、别嘌醇、卡托普利、普萘洛尔、甲基多巴、苯丙胺、苯妥英钠、苯巴比妥、苯茚二酮等
肾结石	维生素 D、维生素 A 及过量抗酸药(如磷酸钙及三硅酸镁等)、乙酰唑胺、非甾体抗炎药、替尼酸、大量维生素 C(4～6 g/d)、磺胺类、丙磺舒及甲氨蝶呤
尿潴留	吗啡、阿片、哌替啶、可待因、罗通定、吲哚美辛、肾上腺素、麻黄碱、阿托品、山莨菪碱、东莨菪碱、溴丙胺太林、樟柳碱、喷托维林、异丙嗪、苯海拉明、氯苯那明、赛庚定、羟嗪、黄酮哌酯、溴丙胺太林、苯丙醇胺、氯丁替诺、氯丙嗪、奋乃静、氟哌啶醇、多塞平、丙米嗪、氯米帕明、苯海索、普罗吩胺、比哌立登、氯美扎酮、丙吡胺、阿普林定、普萘洛尔、拉贝洛尔、尼群地平、硝苯地平、硝酸甘油、氟桂利嗪、氨茶碱、呋塞米、可乐定、甲基多巴、胍那苄、林可霉素、头孢唑林、诺氟沙星、吡哌酸、异烟肼、西咪替丁、曲克芦丁、镇静催眠药、烟碱、氨甲苯酸等
血尿	头孢菌素、多肽抗生素、吡哌酸、诺氟沙星、麦迪霉素、甲硝唑、氨基糖苷类、多黏菌素、青霉素类、磺胺类、抗结核药、西咪替丁、雷尼替丁、卡托普利、环磷酰胺、环孢素、解热镇痛药、抗凝药、乙双吗啉、阿普唑仑、甲苯达唑等
尿失禁	氟哌啶醇、氯丙嗪、甲基多巴、哌唑嗪
影响肾功能试验	甲氧苄啶、西咪替丁
引起肾损害的常用药物	抗菌药物（如青霉素类、磺胺类、利福平、氨基糖苷类、四环素类、两性霉素 B、万古霉素、多黏菌素、氟喹诺酮类等）、抗肿瘤药（如环磷酰胺、长春新碱、氟尿嘧啶、喜树碱、巯嘌呤、顺铂、洛莫司汀、丝裂霉素、链佐星、柔红霉素、光辉霉素、博来霉素等）、生物制品、非甾体抗炎药、钙通道阻滞药、维生素 A 和维生素 D、右旋糖酐 -40、甘油、环孢素等

4．肾功能不全患者的药物剂量调整　肾功能可分为正常、轻度损伤、中度损伤、较重损伤、严重损伤等 5 种状况，肾功能不全者应按肾功能损害的程度调整用药剂量，并按药物成分由肾脏的排泄率（肾小球滤过率）来选择药物和剂量。一般认为，肌酐清除率是测定肾功能的可靠方法，且与药物在血浆中的消除半衰期成反比关系，当肌酐清除率低于正常的 25% 时，则应调整药物治疗剂量。肾功能不全或低下时，药物的血浆半衰期和剂量调整，详见总表 -8。

总表 -8 肝、肾功能不全者和低下时药物的血浆半衰期和剂量调整

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟 10 ~ 50	每分钟＜10	
抗菌药物	阿米卡星	2 ~ 3	86	–	同卡那霉素			–
	庆大霉素	3	60	–	75% ~ 100%	35% ~ 75%	25% ~ 35%	–
	卡那霉素	3	84	–	75%	35% ~ 50%	25%	–
	新霉素	2	12 ~ 24	–	–	每 8 ~ 12 小时 1 次	每 12 ~ 36 小时 1 次	–
	链霉素	2.5	110	–	每 24 小时 1 次	每 24 ~ 48 小时 1 次	每 48 ~ 96 小时 1 次	–
	妥布霉素	2.5	70	–	同庆大霉素			–
	头孢克洛	0.6 ~ 1	1.5 ~ 3.5	–	–	50% ~ 100%	25% ~ 33%	–
	头孢孟多	0.5 ~ 1.8	15 ~ 24	–	–	25% ~ 50%	10% ~ 25%	–
	头孢西丁	0.6 ~ 1	8 ~ 33	–	每 8 小时 1 次	每 8 ~ 12 小时 1 次	每 24 ~ 48 小时 1 次	–
	头孢羟氨苄	1 ~ 1.4	10 ~ 25	–	每 8 小时 1 次	每 12 ~ 24 小时 1 次	每 24 ~ 48 小时 1 次	–
	头孢米星	0.75 ~ 1.5	–	–	–	–	每 12 ~ 24 小时 1 次	–
	头孢噻啶	1.5	10 ~ 23	–	避免应用	同左	同左	–
	头孢噻吩	0.5 ~ 0.9	3 ~ 18	–	–	–	每 8 ~ 12 小时 1 次	严重者慎用
	头孢匹林	0.5	2.5	–	–	–	每 6 ~ 12 小时 1 次	严重者稍减量
	头孢拉定	0.5	2.5	–	–	50%	25%	–
	氯霉素	2 ~ 4	3.5 ~ 7	12	–	–	–	减量
	克林霉素	2 ~ 4	3.5 ~ 5	7 ~ 14	–	–	–	中度及重度者需减量
	多黏菌素 E	1.6 ~ 8	10 ~ 20	–	75% ~ 100%	50% ~ 75%	23% ~ 30%	–
	红霉素	1.5 ~ 3	4 ~ 6	–	–	–	中度及重度患者需减量	
	林可霉素	4 ~ 6.4	10	11.8	每 6 小时 1 次	每 6 ~ 12 小时 1 次	每 12 ~ 24 小时 1 次	中度及重度患者需减量

（续　表）

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟10～50	每分钟＜10	
	氨苄西林	0.8～1.5	6～20	1.9	—	每12～24小时1次	每24～48小时1次	—
	羧苄西林	1	10～20	1.9	每8～12小时1次	每12～24小时1次	每24～48小时1次	—
	邻氯西林	0.5	0.8	—	—	—	—	—
	双氯西林	0.7	1	—	—	—	—	—
	乙氧萘西林	0.6	1.2	1.7	—	—	严重者需减量	
	苯唑西林	0.4	1	稍延长	—	—	—	严重者需稍减
	青霉素	0.5	6～20	—	—	每12小时1次	每12～18小时1次	—
	多黏菌素B	4.5～6	36	—	75%～100%	50%～75%	25%～30%	—
	多西环素	15～24	25	—	—	—	—	稍减量
	米诺环素	12～15	14～30	—	—	—	—	稍减量
	四环素	6～15	7～75	—	不用	不用	不用	—
	万古霉素	4～8	200～240	—	每24～72小时1次	每72～240小时1次	每240小时1次	—
	灰黄霉素	10～22	—	—	—	—	—	严重者需减量
	咪康唑	20～24	24	—	—	—	—	严重者需减量
	孟德立酸	3～6	—	—	—	—	不用	—
	甲硝唑	16～14	8～15	—	—	每8～12小时1次	每12～24小时1次	严重者需减量
	萘啶酸	1～2.5	21	—	—	—	不用	严重者需减量
	呋喃妥因	0.3	1	—	—	不用	不用	慎用
	磺胺甲噁唑	9～11	10～50	—	每12小时1次	每18小时1次	每18～24小时1次	严重者需减量
	磺胺异噁唑	4.5～7	6～12	—	—	每8～12小时1次	每12～24小时1次	严重者需减量
	甲氧苄啶	8～16	24～46	—	—	每8～12小时1次	每12～24小时1次	—

（续 表）

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟10～50	每分钟＜10	
抗结核药	乙胺丁醇	3.3	＞10	–	–	50%每24小时1次或100%每36小时1次	25%每24小时1次或100%每18小时1次	–
	异烟肼	1.4	2.3	6.7	–	–	66%～100%	中度及严重者需减量
	利福平	2.3	3.1～5	延长	–	–	–	有蓄积性
抗病毒药	金刚烷胺	12～36	＞24	–	有蓄积性	同左	同左	–
镇痛药	对乙酰氨基酚	2	–	–	每4小时1次	每4小时1次	每4小时1次	不用
	阿司匹林	2～19	–	–	每4小时1次	每4～6小时1次	不用	不用
	可待因	3.4	–	–	每3～4小时1次	每3～4小时1次	每3～4小时1次	稍减量
	吗啡	2.3	–	–	每3～4小时1次	每3～4小时1次	每3～4小时1次	稍减量
	哌替啶	3	–	7	每3～4小时1次	每3～4小时1次	每3～4小时1次	稍减量
	美沙酮	13～55	–	–	每6小时1次	每8小时1次	每8～12小时1次	稍减量
	喷他佐辛	2	–	–	每4小时1次	每4小时1次	每4小时1次	稍减量
镇静催眠药	水合氯醛	7～14	–	–	每24小时1次	不用	不用	减量
	氯氮䓬	5～30	–	63	每6～8小时1次	每6～8小时1次	每6～8小时1次	减量
	地西泮	29～90	–	105～164	每8小时1次	每8小时1次	每8小时1次	减量
	氟西泮	47～100	–	–	每24小时1次	每24小时1次	每24小时1次	减量
	格鲁米特	5～22	–	–	每24小时1次	不用	不用	减量
	己巴比妥	3.7	–	5～13	每8小时1次	每8小时1次	每8小时1次	减量
	甲丙氨酯	6～17	–	32	每6小时1次	每9～12小时1次	每12～18小时1次	稍缓慢
	甲喹酮	10～43	–	–	每24小时1次	不用	不用	减量
	奥沙西泮	6～25	–	–	每8小时1次	每8小时1次	不用	–

（续　表）

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟 10～50	每分钟＜10	
	戊巴比妥	18～48	–	–	每 8～24 小时 1 次	每 8～24 小时 1 次	每 8～24 小时 1 次	减量
	硫喷妥钠	3.8	–	–	–	–	稍减量	减量
抗高血压药	可乐定	7～12	24	–	减量	减量	减量	可能减量
	胍乙啶	120～140	–	–	–	减量	减量	可能减量
	肼屈嗪	2～3	延长	–	减量	减量	减量	减量
	甲基多巴	2～3	6	–	–	–	–	不用
	米诺地尔	4.2	42	–	–	–	–	可能减量
	哌唑嗪	2.5～4	–	–	–	–	–	可能减量
	利血平	46～165	–	–	–	–	–	可能减量
利尿药	氯噻酮	51	100	–	–	无效	无效	–
	依地尼酸	1	延长	–	不用	不用	不用	可能减量
	呋塞米	0.5～1	延长	–	–	–	–	可能减量
	氢氯噻嗪	2.5	24	–	–	可能无效	可能无效	–
	汞利尿药	2～3	16	–	不用	不用	不用	–
	螺内酯	16	延长	–	减量	不用	不用	–
	氨苯蝶啶	2	–	–	–	不用	不用	减量
抗心律失常药及强心苷药	溴苄铵	4～17	31.5	–	每 8 小时 1 次	每 24～48 小时 1 次	不用	–
	洋地黄毒苷	168～192	200	–	–	–	–	–
	地高辛	30～40	87～100	–	–	减少 50%	减少 50%～75%	–
	丙吡胺	4.8～8.2	43	–	每 6 小时 1 次	每 12～24 小时 1 次	每 24～48 小时 1 次	–
	利多卡因	1.3～2.3	1.3～2.5	5	–	–	–	负荷量照旧，滴入速率减慢一半

（续 表）

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟 10 ~ 50	每分钟＜10	
	普鲁卡因胺	2.2 ~ 4	9 ~ 16	—	每 3 ~ 6 小时 1 次	每 6 ~ 12 小时 1 次	每 12 ~ 24 小时 1 次	—
	普萘洛尔	4	2 ~ 3.2	延长	—	—	—	明显减量
	奎尼丁	3 ~ 16	3 ~ 16	—	—	—	—	—
	维拉帕米	3 ~ 7	—	—	慎用	慎用	慎用	
抗痛风及抗炎药	别嘌醇	0.7	延长	—	一日 300 mg	一日 200 mg	一日 100 mg	—
	秋水仙碱	0.3	0.7	0.2	—	不得长期应用		—
	非诺洛芬	1.5 ~ 2.9	—	—	—	—	—	—
	布洛芬	2	—	—	—	—	—	—
	吲哚美辛	2 ~ 11	2	—	—	—	—	—
	萘普生	12 ~ 15	—	—	—	—	不用	—
	青霉胺	—	—	—	—	不用	不用	—
	保泰松	40 ~ 140	27 ~ 96	40 ~ 190	—	—	—	—
	泼尼松	2.5 ~ 3.5	—	3.5	—	—	不用	—
	丙磺舒	3 ~ 17	—	—	—	不用	不用	—
	舒林酸	1.5 ~ 3.0	—	—	—	—	从半量开始	—
免疫抑制药及抗肿瘤药	多柔比星	1	—	延长	—	—	稍减量	胆红素＜2 ~ 3 时减量 20% ~ 30%
	巯嘌呤	1	稍延长	稍延长	—	—	稍减量	可能引起肝毒性
	博来霉素	2	延长	—	—	可能减量	减量	—
	白消安	长	—	—	—	—	—	—
	顺铂	0.4 ~ 0.8	延长	—	—	减量	减量	—

（续　表）

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟10～50	每分钟＜10	
	环磷酰胺	3～10	延长	延长	—	—	可能减量	稍减量
	阿糖胞苷	0.1	—	—	—	—	可能减量	—
	氟尿嘧啶	0.1	—	稍延长	—	—	—	稍减量
	美法仑	2	—	—	—	—	—或稍减量	—
	甲氨蝶呤	2.3	延长	—	—	—	减量	慎用
	长春碱	0.1	—	可能延长	—	—	—或稍减量	稍减量
	长春新碱	0.1	—	可能延长	—	—	—或稍减量	稍减量
作用于神经与精神系统药物	新斯的明	0.9～1.3	3	—	—	—	减量50%	—
	吡斯的明	1.5～4.3	5.1～10.3	—	—	—	减量50%	—
	卡马西平	19～55	—	—	—	—	—	—
	乙琥胺	53～66	—	—	—	—	稍减量	—
	氟哌啶醇	10～36	—	—	—	—	—	—或稍减量
	左旋多巴	0.8～1.6	—	—	—	—	—	—
	锂盐	14～28	延长	—	—或稍减	不用	不用	—
	苯巴比妥	60～150	—	—	—	—	稍减量	慎用
	氯丙嗪	11～42	—	—	—	—	—或稍减	稍减，慎用
	苯妥英钠	10～30	6～11	—	—	—	—	严重时减量
	阿米替林	12～56	—	—	—	—	—	稍减，慎用
	三甲双酮	16	—	—	—	不用	不用	—
	丙戊酸	10～15	—	—	—	—	稍减量	稍减量

（续　表）

类别	药物	血浆半衰期（小时）			肾衰竭者，不同肾小球滤过率（ml）时剂量的调整（表内数字为正常人剂量的%）			肝功能低下时剂量的调整
		正常人	肾衰竭者	肝病患者	每分钟＞50	每分钟 10 ～ 50	每分钟＜10	
抗糖尿病药	氯磺丙脲	25 ～ 42	延长	—	稍减量	不用	不用	慎用
	胰岛素	0.08 ～ 0.25	延长	—	减量	减量	减量	根据血糖高低决定剂量
	甲苯磺丁脲	4 ～ 8	3 ～ 9	3 ～ 7	—	—	—	—
其他	西咪替丁	1.4 ～ 2.4	3 ～ 10	—	每 6 小时 300 mg	每 8 小时 300 mg	每 12 小时 300 mg	—
	苯海拉明	3 ～ 8	—	—	—	—	— 或稍减	—
	肝素	1 ～ 2	— 或稍延长	1.3	—	—	—	—
	丙胺太林	2.2 ～ 3.7	—	—	—	—	— 或稍减	—
	丙硫氧嘧啶	1 ～ 2	—	—	—	—	—	—
	茶碱	3 ～ 12	—	10 ～ 59	—	—	—	减少 50%
	华法林	15 ～ 87	21 ～ 43	17 ～ 29	—	—	—	—

肾功能不全者也可按肌酐清除率调整剂量，每分钟≥ 50 ml 者无需调整剂量，每分钟≥ 30 ml 者，视具体药物调整剂量，每分钟≤ 10 ml 者，应禁用

各论

第 1 章 神经与精神疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 缺血性脑血管病
- 出血性脑血管病
- 痴呆
- 帕金森病
- 特发性震颤、舞蹈病
- 变形性肌张力不全
- 脑囊虫病
- 急性脊髓炎
- 多发性硬化病
- 低钾型周期性瘫痪
- 重症肌无力
- 多发性肌炎
- 癫痫
- 癫痫持续状态
- 热性惊厥

- 急性偏头痛
- 紧张性头痛
- 神经痛
- 吉兰-巴雷综合征
- 面神经麻痹
- 注意缺陷多动障碍
- 抽动障碍
- 失眠症
- 抑郁症
- 焦虑
- 双相情感障碍
- 精神病性障碍

1.1 脑血管病及其用药

1.1.1 缺血性脑血管病及其用药

脑血管病具有高发病率、高致残率和高病死率特点，对缺血性脑血管病的治疗不仅要追求急性期的安全、有效、及时，同时还要重视危险因素的干预，做好一级预防和二级预防工作。现重点介绍短暂性脑缺血发作（transient ischemic attack，TIA）和脑血栓形成的药物治疗。

1.1.1.1 短暂性脑缺血发作的药物治疗

（1）抗血小板药：对TIA尤其是反复发生TIA的患者应首先考虑选用抗血小板药（见4.11）。①环氧酶抑制药：大多数TIA患者首选环氧酶抑制药阿司匹林（ASA）。剂量为一日50～150mg，顿服。②磷酸二酯酶抑制药：磷酸二酯酶抑制药的缓释制剂双嘧达莫（DPA）（200mg），联合应用小剂量阿司匹林（25mg），可加强其药理作用，一日2次。③有条件者、高危人群或对阿司匹林不能耐受者可选用二磷酸腺苷受体（ADP）拮抗药氯吡格雷，常用剂量为一日75mg。④频繁发作TIA时，也可考虑选用血栓素A_2（TXA_2）合成酶抑制药奥扎格雷静脉注射。

（2）抗凝药：抗凝治疗目前不作为TIA的常规治疗，但临床上对于伴发房颤和冠心病的TIA患者（感染性心内膜炎除外）、频繁发作TIA患者、椎-基底动脉TIA患者及抗血小板治疗无效的患者可考虑选用抗凝治疗。通常选用低分子量肝素，也可选用普通肝素，但应密切监测凝血功能。

（3）降纤药：对存在血液成分的改变（如纤维蛋白原含量明显增高的患者）或频繁发作但以其他治疗无效的患者可考虑选用降纤酶。

（4）扩容药：心功能不全者禁用。可选用低分子右旋糖酐或706代血浆。

（5）钙通道阻滞药：血压低者慎用，可扩张脑血管，防止脑动脉痉挛。可选用如尼莫地平、氟桂利嗪。

（6）其他药：川芎嗪、银杏叶提取物等具有活血化淤、改善微循环、降低血黏度的作用。倍他司汀可用于眩晕。偶尔也可选用罂粟碱。

1.1.1.2 脑梗死的药物治疗

脑梗死的治疗应根据不同的病因、发病机制、临床类型、发病时间等确定针对性强的治疗方案，实施以分型、分期为核心的个体化治疗。在一般内科支持治疗（特别注意血压的调控）的基础上，可酌情选用改善脑循环、脑保护、抗脑水肿降颅压等措施。

通常按病程可分为急性期（1个月），恢复期（2～6个月）和后遗症期（6个月以后）。重点是急性期的分型治疗，腔隙性脑梗死不宜脱水，主要是改善循环；大、中梗死应积极抗脑水肿降颅压，防止脑疝形成。在＜6小时的时间窗内有适应证者可行下列溶栓等治疗。

（1）溶栓治疗：缺血性脑卒中发病3小时内应用阿替普酶（t-PA）或重组组织型纤溶酶原激活物（rt-PA）的静脉溶栓疗法。对脑CT无明显低密度改变、意识清楚的急性缺血性脑卒中患者，在发病6小时之内，采用尿激酶静脉溶栓治疗比较安全、有效。基底动脉血栓溶栓治疗的时间窗和适应证可以适当放宽。对发病6小时以内的急性缺血性脑卒中患者，在有经验和有条件的单位，可以考虑进行动脉内溶栓治疗。

适应证：①年龄18～75岁；②发病在6小时以内；③脑功能损害的体征持续存在超过1小时，且比较严重，脑卒中评

分（NIHSS）7 ~ 22 分；④脑 CT 已排除颅内出血，且无早期脑梗死低密度改变及其他明显早期脑梗死改变。

禁忌证：①既往有颅内出血，包括可疑蛛网膜下腔出血；近 3 个月有头颅外伤史；近 3 周内有胃肠或泌尿系统出血；近 2 周内进行过大的外科手术；近 1 周内有不可压迫部位的动脉穿刺。②近 3 个月有脑梗死或心肌梗死史，但陈旧小腔隙未遗留神经功能体征者除外。③严重心、肾、肝功能不全或严重糖尿病者。④体检发现有活动性出血或外伤（如骨折）的证据。⑤已口服抗凝药，且 INR>1.5；48 小时内接受过肝素治疗（aPTT 超出正常范围）。⑥血小板计数 $<100\times10^9$/L，血糖 <2.7 mmol/L（50 mg）。⑦血压，收缩压 >180 mmHg，或舒张压 > 100 mmHg。⑧妊娠期妇女。

溶栓药物治疗方法：①尿激酶：100 万 ~ 150 万 U，溶于氯化钠注射液 100 ~ 200 ml 中，持续静脉滴注 30 分钟。②阿替普酶（t-PA）：剂量为 0.9 mg/kg（最大剂量 90 mg），先静脉注射 10%（1 分钟），其余剂量连续静脉滴注，60 分钟滴完。静脉溶栓治疗首选 t-PA，无条件采用 t-PA 时，可用尿激酶替代。

溶栓治疗时的注意事项：①患者出现严重的头痛、急性血压增高、恶心或呕吐，应立即停用溶栓药物，紧急进行头颅 CT 检查。②血压的监测。溶栓的最初 2 小时内每 15 分钟测定一次，随后 6 小时内为每半小时测定一次，此后，每 1 小时一次，直至 24 小时。如果收缩压 ≥ 185 mmHg 或者舒张压 ≥ 105 mmHg，更应多次检查血压。可酌情选用 β 受体拮抗药，如拉贝洛尔。亦可选用乌拉地尔等。如收缩压 >230 mmHg 或舒张压 >140 mmHg，可静脉滴注硝普钠。③溶栓治疗后 24 小时内一般不用抗凝、抗血小板药，24 小时后无禁忌证者可用阿司匹林 300 mg，连续 10 日，以后改为维持量 75 ~ 100 mg。

（2）降纤治疗：脑梗死急性期血浆中纤维蛋白原和血液黏滞度增高。可选用降纤酶。可显著降低血浆纤维蛋白原水平，增加纤溶活性及抑制血栓形成，适用于合并高纤维蛋白原血症患者。但应注意监测纤维蛋白原水平，降至 1.3 g/L 以下时，出血倾向会增加。

（3）抗凝治疗：抗凝治疗的目的主要是防止缺血性脑卒中的早期复发、血栓的延长及防止堵塞远端的小血管继发血栓形成，促进侧支循环。可选用普通肝素、低分子量肝素。抗凝治疗的原则如下。①一般急性脑梗死患者不推荐常规立即使用抗凝药。②使用溶栓治疗的患者，一般不推荐在 24 小时内使用抗凝药。③如果无出血倾向、严重肝肾疾病、血压 > 180/100 mmHg 等禁忌证时，下列情况可考虑选择性使用抗凝药，如心源性梗死（如人工瓣膜、心房颤动，心肌梗死伴附壁血栓、左心房血栓形成等）患者，容易复发脑卒中；缺血性脑卒中伴有活性蛋白 C 或 S 缺乏、蛋白 C 抵抗等易栓症患者，症状性颅外夹层动脉瘤患者，颅内外动脉狭窄患者；卧床的脑梗死患者可使用低剂量肝素或相应剂量的低分子量肝素预防深静脉血栓形成和肺栓塞。

（4）抗血小板药：大多数无禁忌证的不溶栓患者应在脑卒中后尽早（最好 48 小时内）开始使用阿司匹林，溶栓的患者应在溶栓 24 小时后使用阿司匹林。具体可参见 TIA 的治疗。

（5）扩容治疗：对于脑血流低灌注所致的急性脑梗死（如分水岭梗死）可酌情考虑扩容治疗，如低分子右旋糖酐，但应注意可能加重脑水肿、心力衰竭等并发症。

（6）其他药物：川芎嗪、银杏叶提取物等可降低血小板聚集、抗凝、改善脑血流、降低血黏滞度等，对缺血性脑卒中的预后有所帮助。常用的还有胞二磷胆碱、尼麦角林、双氢麦角碱、吡拉西坦、茴拉西坦、奥拉西坦、尼莫地平等。曲克芦丁、己酮可可碱等有时也可选用。

（7）二级预防：①高血压，应用抗高血压药的原则是既要有效和持久地降低血压，又不至于影响重要器官的血流量。各类型的抗高血压药均可选择。②高血脂，羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药（他汀类）降脂药不仅能有效降低 TCHO 及 LDL 水平，还能稳定斑块，从而减少脑卒中的发生。③高同型半胱氨酸血症，高同型半胱氨酸血症与脑卒中发病有相关关系。叶酸

与维生素 B_6 和维生素 B_{12} 联合应用，可降低血浆半胱氨酸水平。一般人群应以饮食调节为主，对高半胱氨酸血症患者，可考虑应用叶酸 2 mg 和维生素 B_6 30 mg、维生素 B_{12} 500 μg 予以治疗。

1.1.1.3 脑栓塞的药物治疗

脑栓塞（cerebral embolism）强调不同病因不同治疗，最好能去除栓子来源。非感染性心源性栓塞主张抗凝治疗。对已明确诊断为非瓣膜病变性房颤诱发的心源性栓塞患者二级预防可使用华法林抗凝治疗，剂量为一日 2 ~ 4 mg，国际标准化比值（INR）应控制在 2.0 ~ 3.0。其余药物治疗见 1.1.1.2。

1.1.1.4 腔隙性脑梗死的药物治疗

腔隙性脑梗死（lacunar infarction）以预防为主，服小剂量阿司匹林，一次 75 ~ 150 mg，一日 1 次。积极控制血压、血糖、血脂。急性期治疗以改善血液循环为主，其余药物治疗见 1.1.1.2。

降纤酶 [保（乙）]

Defibrase

【适应证】用于血栓栓塞性疾病，如脑血栓形成、脑栓塞、四肢动静脉血栓形成、视网膜静脉栓塞等。

【注意事项】(1) 有药物过敏史、消化道溃疡史、脑血管病后遗症、70 岁以上老年人慎用。(2) 用药时不要进行大血管手术、穿刺。(3) 本品稀释后应立即使用，静脉滴注速度宜慢。(4) 用药后 5 ~ 10 日应尽量少活动，以防意外创伤。

【禁忌证】对本品及蛇毒过敏者禁用。有出血史、出血性病灶和凝血功能低下者禁用。妊娠及哺乳期妇女、儿童禁用。对正在使用抗凝药、抗血小板药者、重度肝肾功能不全者禁用。

【不良反应】(1) 常见有出血，但一般轻微，如胃肠道、泌尿生殖道、腹膜后或颅内出血、浅层的或表面的出血。(2) 少数人有头晕、疲乏、齿龈出血、皮下出血点、瘀斑，极个别严重者可发生过敏性休克。

【用法与用量】(1) 用药前应进行皮肤过敏试验，以本品 0.1 ml 加 0.9% 氯化钠注射液稀释至 1 ml，皮内注射 0.1 ml，15 分钟后观察结果，皮试阴性者方可使用。(2) 静脉滴注：成人一般首次剂量 10 BU，维持量为 5 BU，隔日 1 次，加入 0.9% 氯化钠注射液 100 ~ 200 ml 中，持续静脉滴注 1 ~ 2 小时，连续 3 ~ 4 次为 1 个疗程。

【制剂与规格】注射用降纤酶：① 5 BU；② 10 BU。

降纤酶注射液：① 5 BU；② 10 BU。

蚓激酶 [保（乙）]

Lumbrokinase

【适应证】用于缺血性脑血管病中纤维蛋白原增高及血小板凝集率增高的患者。

【注意事项】(1) 本品必须饭前服用。(2) 有出血倾向者慎用。(3) 儿童、妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】极少数患者可出现轻度头痛、头晕、便秘、恶心等。

【用法与用量】口服：一次 60 万 U，一日 3 次，或遵医嘱。饭前半小时服用。3 ~ 4 周为 1 个疗程，可连服 2 ~ 3 个疗程，也可连续服用至症状好转。

【制剂与规格】蚓激酶肠溶胶囊：30 万 U。

巴曲酶 [保（乙）]

Batroxobin

【适应证】(1) 急性脑梗死。(2) 改善各种闭塞性血管病（如血栓闭塞性脉管炎、深部静脉炎、肺栓塞等）引起的缺血性症状。(3) 改善末梢及微循环障碍（如突发性聋、振动病）。

【注意事项】(1) 用药后可能有出血或止血延缓现象，治疗前及治疗期间应对患者进行血纤维蛋白原和血小板凝集情况的检查，并密切注意临床症状。首次用药后血纤维蛋白原低于 100 mg/dl 者，给药治疗期间出现出血或可疑出血时，应终止给药，并采取输血或其他措施。(2) 该药有可能引起血肿，使用后，临床上应避免进行穿刺检查或治疗。对于浅表静脉穿刺部位有止血延缓现象发生时，应采用压迫

止血法。(3) 用药前出现以下情况应告知医生：①手术或拔牙时；②到其他医院或部门就诊时；③用药期间应避免从事可能造成创伤的工作。(4) 妊娠或有妊娠可能性的妇女，应在治疗上的有益性大于危险性时才能使用，使用本品时应避免与水杨酸类药物（如阿司匹林）合用。哺乳期，一般应避免使用本制剂，如果必须使用本制剂则应停止哺乳。尚未进行对儿童用药后的安全性试验研究。

【禁忌证】有出血患者、新近手术患者、有出血可能的患者、正在使用具有抗凝作用及抑制血小板功能药物（如阿司匹林）者和正在使用抗纤溶制剂者、用药前血纤维蛋白原浓度低于 100 mg/dl 者、重度肝或肾功能障碍及其他（如乳头肌断裂、心室中隔穿孔、心源性休克、多脏器功能衰竭症）患者、对本制剂有过敏史者禁用。有药物过敏史、消化道溃疡史、患有脑血管病后遗症、70 岁以上高龄患者慎用。

【不良反应】多为轻度，主要为注射部位出血、创面出血、头痛、头晕耳鸣；偶有轻度皮下瘀斑，鼻出血，恶心，呕吐，上腹不适，皮疹，发热，ALT、AST、BUN、Cr 升高及尿隐血阳性；罕有引起休克的情况，故应仔细观察病情，发现异常时终止给药，并采取输血等妥当的措施。

【用法与用量】成人首次剂量通常为 10 BU，维持量可视病人情况酌情给予，一般为 5 BU，隔日 1 次，药液使用前用 100 ml 以上的 0.9% 氯化钠注射液稀释，静脉滴注 1 小时以上。下列情况首次使用量应为 20 BU，以后维持量可减为 5 BU：①给药前血纤维蛋白原浓度达 400 mg/dl 以上；②突发性聋的重症患者。通常疗程为 1 周，必要时可增至 3 周；慢性治疗可增至 6 周，但在延长期内每次用量减至 5 BU，隔日静脉滴注。急性脑梗死患者，首次剂量为 10 BU，隔日 1 次，共 3 次，另两次各为 5 BU。使用前用 250 ml 0.9% 氯化钠注射液稀释，静脉滴注 1 小时以上。此后应有其他治疗脑梗死药物继续治疗。

【制剂与规格】巴曲酶注射液：0.5 ml：5 BU。

重组人组织型纤溶酶原激酶衍生物

Recombinant Reteplase

【适应证】瑞替普酶是野生型组织型纤溶酶激活剂 (tPA) 缺失突变物，能催化内源性纤溶酶原转变为纤溶酶，从而溶解纤维蛋白细丝，发挥溶栓作用，达到疏通血管，迅速缓解症状。用于成人由冠状动脉血栓形成引起的急性心肌梗死的溶栓治疗。

【注意事项】(1) 应用剂量较大时，少数患者可出现出血，若发生严重出血应即停药，并输入新鲜血液。(2) 为防止效价降低，溶解时宜用少量注射用水溶解，不宜与葡萄糖溶液或注射用水稀释。(3) 注射时应使用单独的静脉通路，不宜与其他药物配伍应用，避免剧烈振摇。水溶液不稳定，需新鲜配制，已配制的注射液在室温 (25℃) 下不能超过 8 小时，低温 (2 ~ 5℃) 不可超过 24 小时。(4) 少数有过敏反应，如头痛、恶心、呕吐、食欲缺乏等，严重者应立即停药，对发热者可口服对乙酰氨基酚退热，但不能应用阿司匹林和其他有抗血小板作用的退热药。(5) 用药期间宜监测患者心电图，出现心律不齐时应即停药，并采取抢救措施。(6) 本品应在出现症状后尽早应用，给药后备用治疗心动过缓、室性兴奋性增高的抗心律失常药。

【不良反应】常见出血（颅内、脑膜后、消化道、泌尿道、呼吸道、穿刺或破损部位）、过敏、恶心、呕吐、发热、呼吸困难、低血压；罕见胆固醇栓塞。

【禁忌证】近期内有严重出血、消化道溃疡、结肠炎、食管静脉曲张、主动脉瘤、出血性疾病和出血倾向、近期在 2 周内有过手术、外伤、穿刺、活体组织检查者、严重高血压、近期 6 个月内发生中风者禁用。妊娠期妇女、临产前 2 周内和产后 14 日内者禁用。70 岁以上老年患者、严重肝功能不全者禁用。

【用法与用量】静脉注射：一次 10 MU 双弹丸注射给药，每次注射时间 2 分钟，两次注射时间宜间隔 30 分钟。

【制剂与规格】注射用重组人组织型纤溶酶原激酶衍生物：每瓶 5.0 MU。

尼莫地平 [基(基), 保(甲/乙)]

Nimodipine

【适应证】缺血性脑血管病、偏头痛、蛛网膜下腔出血所致脑血管痉挛，急性脑血管病恢复期的血液循环改善，突发性聋，轻中度高血压。

【注意事项】(1) 本品的代谢物具有毒性反应，肝功能不全者应慎用。(2) 动物实验提示本品具有致畸性。(3) 药物可由乳汁分泌，哺乳期妇女不宜应用。(4) 下列情况慎用：脑水肿、颅内压增高、低血压。(5) 本品可影响驾车和操作器械的能力。(6) 伴有严重心、肾功能不全者应定期随访检查，颅内压升高或脑水肿患者应密切监测。(7) 禁与利福平及抗癫痫药苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平合用。

【禁忌证】对本品成分过敏者，严重肝功能不全。

【不良反应】头晕，头痛，中枢兴奋；血压下降，心动过速，心动过缓；面部潮红，出汗，热感，皮肤刺痛；胃肠道不适，胃肠道出血，偶见肠梗阻；肝功能损害，血小板减少。

【用法与用量】(1) 口服：①急性脑血管病恢复期，一次 30～40 mg，一日 4 次。②缺血性脑血管病，普通制剂一日 30～120 mg，分 3 次服用，连续 1 个月。缓释制剂一次 60 ～ 120 mg，一日 2 次，连续 1 个月。③偏头痛，一次 40 mg，一日 3 次，12 周为 1 个疗程。④蛛网膜下腔出血所致脑血管痉挛，一次 40 ～ 60 mg，一日 3～4 次，3～4 周为 1 个疗程。⑤突发性聋，一日 40～60 mg，分 3 次服用，5 日为 1 个疗程，一般用药 3 ～ 4 个疗程。⑥轻中度高血压，一次 40 mg，一日 3 次，一日最大剂量为 240 mg。(2) 静脉注射：用于动脉瘤性蛛网膜下腔出血后脑血管痉挛引起的缺血性神经损伤。体重低于 70 kg 或血压不稳定，开始 2 小时 0.5 mg/h，耐受良好，2 小时后可增至 1 mg/h；体重 > 70 kg，开始 1 mg/h，耐受良好，2 小时后可增至 2 mg/h。

【制剂与规格】尼莫地平片：① 20 mg；② 30 mg。

尼莫地平胶囊：20 mg。

尼莫地平缓释片：60 mg。

注射用尼莫地平：①2 mg；②4 mg；③8 mg。

尼莫地平注射液：① 10 ml ：2 mg；②20 ml：4 mg；③40ml：8mg；④50ml：10 mg；⑤ 100 ml ：20 mg。

桂利嗪 [保(乙)]

Cinnarizine

【适应证】用于脑血栓形成、脑栓塞、脑动脉硬化、脑出血恢复期、蛛网膜下腔出血恢复期、脑外伤后遗症、内耳眩晕症、冠状动脉硬化及由于末梢循环不良引起的疾病等治疗。也可用于慢性荨麻疹，老年性皮肤瘙痒等过敏性皮肤病，前庭性疾病，诸如眩晕、耳鸣、恶心、呕吐及运动病。

【注意事项】(1) 由于本品可由乳汁分泌，虽然尚无致畸和对胚胎发育有影响的研究报告。但原则上孕妇和哺乳期妇女不用此药。(2) 患有帕金森病等锥体外系疾病时，应当慎用本品。驾车和机械操作者慎用，以免发生意外。(3) 疲惫症状逐步加重者应当减量或停药。(4) 长期应用出现锥体外系症状时，应当减量或停服药。

【禁忌证】本品过敏史，或有抑郁症病史的患者禁用此药。

【不良反应】(1) 常见嗜睡、疲乏、某些患者可出现体重增加（一般为一过性)、出汗、扁平苔藓、狼疮等皮肤性反应。(2) 长期服用偶见抑郁和锥体外系反应，如运动徐缓、强直、静坐不能、口干、肌肉疼痛及皮疹。

【用法与用量】口服：一次 25～50 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】桂利嗪片：15 mg。

氟桂利嗪 [保(乙)]

Flunarizine

【适应证】用于有先兆或无先兆偏头痛的防治，由前庭功能紊乱引起的眩晕的对症治疗。

【注意事项】(1) 肝功能不全者、老年患者慎用。(2) 儿童慎用。(3) 老年人可酌情减量。(4) 口服对预防偏头痛有效，静脉用药对治疗急性偏头痛有效。(5) 治疗过程中疲惫现象逐渐加剧，应停止本品

治疗。(6) 服药期间不宜驾车或操作机械。

【禁忌证】对氟桂利嗪或桂利嗪过敏、有抑郁病史者及其他锥体外系疾病患者。孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 嗜睡和疲乏最常见，为一过性。(2) 长期服用可出现抑郁，以女性患者较常见。(3) 可见锥体外系症状，表现为运动迟缓、静坐不能、下颌运动障碍、震颤、强直等。多在用药3周后出现，停药后消失。老年人较易发生。(4) 少数患者可出现失眠、焦虑等。少见口干、恶心、胃部烧灼感、胃痛、便秘。(5) 部分患者还可出现体重增加或伴有食欲增加，为一过性。(6) 另可见 ALT 及 AST、乳酸脱氢酶 (LDH) 升高。(7) 少数患者可出现皮疹、溢乳、肌酸痛等症状，多为短暂性的。

【用法与用量】口服：(1) 偏头痛的防治，起始剂量每晚 10 mg (65 岁以上 5 mg)，维持治疗时每 7 日连续给药 5 日，每晚 10 mg (65 岁以上 5 mg)。(2) 眩晕，控制症状后停药，剂量同上。(3) 65 岁以上血管性偏头痛患者起始剂量为一日 5 mg，每晚口服。如在治疗 2 个月后未见明显改善，应停止用药；维持治疗为一日 10 mg，每周给药 5 日。治疗 6 个月后也应停药，复发时重新使用起始剂量。

【制剂与规格】盐酸氟桂利嗪片：① 5 mg；② 6 mg。

盐酸氟桂利嗪胶囊：① 3mg；② 5mg。

桂哌齐特 [保 (乙)]

Cinepazide

【适应证】(1) 脑动脉硬化、一过性脑缺血发作、脑血栓形成、脑栓塞、蛛网膜下腔出血、脑外伤术后恢复期、脑出血后遗症和脑外伤后遗症。(2) 冠心病、心绞痛，如用于心肌梗死，应配合有关药物综合治疗。(3) 下肢动脉粥样硬化病、血栓闭塞性脉管炎、动脉炎、雷诺病。(4) 眼底血管硬化、阻塞、缺血所致的眼病，缺血所致的耳蜗前庭功能失常，突发性聋、耳鸣等。(5) 糖尿病所导致的周围血管病变及微循环障碍。

【禁忌证】脑出血止血不完全者（止血困难）、白细胞计数减少者。

【不良反应】偶见胃部不适、头痛、失眠、皮疹、白细胞减少，故长期用药时注意定期检查血象。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：160 ~ 320 mg 溶于 10% 葡萄糖注射液或 0.9% 氯化钠注射液 250 ~ 500 ml 中，一日 1 次，连续用药 14 ~ 28 日为 1 个疗程。(2) 静脉注射：一日 160 mg，稀释后缓慢静脉注射，根据病情 10 ~ 45 日为 1 个疗程。(3) 肌内注射：80 mg，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】马来酸桂哌齐特注射液：2 ml ∶ 80 mg。

己酮可可碱 [保 (乙)]

Pentoxifylline

【适应证】改善缺血性卒中后脑循环，亦可用于周围血管病，如伴有间歇性的跛行的慢性闭塞性脉管炎等。

【注意事项】(1) 对有出血倾向或新近有出血史者不宜应用，以免诱发出血。(2) 动物实验中提示长期应用己酮可可碱有增加纤维瘤发生机会，但没有明显致畸。(3) 严重冠心病，低血压患者慎用。(4) 哺乳期妇女不宜应用本品。

【不良反应】(1) 常见头晕，头痛，厌食，腹胀，呕吐等。(2) 少见有：心血管系统的血压降低、呼吸不规则、水肿；神经系统的焦虑、抑郁、抽搐；消化系统的厌食、便秘、口干、口渴；皮肤的血管性水肿、皮疹、指甲发亮；视物模糊、结膜炎、中央盲点扩大，以及味觉减退、涎液增多、白细胞减少、肌肉酸痛、颈部腺体肿大和体重改变等。(3) 偶见心绞痛、心律失常、黄疸、肝炎、肝功能异常、纤维蛋白原降低、再生障碍性贫血和白血病等。

【禁忌证】急性心肌梗死、严重冠状动脉硬化、严重高血压患者、妊娠期妇女禁用。

【用法与用量】口服：一次 0.2~0.4 g，1 日 2 ~ 3 次。缓释片：一次 400 mg，一日 1 次。静脉注射：一次 100 ~ 200 mg 缓慢注射（超过 5 分钟）。静脉滴注：初始剂量为 100 mg，加入 5% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 中滴注，最大滴速不超过每小时 100 mg，输液时间应大于 90 ~ 180 分钟，以后根据患者耐受性，一日可增加 50 mg（但一次量不超过 300 mg），

一日 1 ～ 2 次。动脉滴注：一次 100 ～ 300 mg，用氯化钠注射液 20 ～ 50 ml 稀释后于 10 ～ 30 分钟滴完。严重肾功能不全时（肌酐清除率低于每分钟 10 ml）应减量，严重肝功能损害者依据个体耐受性减少剂量。

【制剂与规格】己酮可可碱肠溶片：0.1 g。

己酮可可碱缓释片：400 mg。

己酮可可碱注射液：① 2 ml ：100 mg；② 5 ml ：100 mg；③ 5 ml ：300 mg；④ 15 ml ：300 mg。

倍他司汀 [保（乙）]

Betahistine

【适应证】用于伴发的眩晕和头晕感，如梅尼埃病、眩晕症、梅尼埃综合征。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 有消化性溃疡史和活动期消化性溃疡、支气管哮喘、肾上腺髓质瘤者慎用。(3) 老年人使用本品时应注意调整剂量。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 可有口干、食欲缺乏、恶心、呕吐、胃部不适、心悸等，偶有头晕、头痛、头胀、多汗。(2) 偶见出血性膀胱炎、发热。偶可出现过敏反应，如皮疹、皮肤瘙痒等。

【用法与用量】口服或注射：一次 4 ～ 8 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】盐酸倍他司汀片：4 mg。

甲磺酸倍他司汀片：6 mg。

盐酸倍他司汀口服液：4 mg。

盐酸倍他司汀注射液：① 2ml ：2mg；② 2 ml ：4 mg；③ 4 ml ：4 mg。

注射用盐酸倍他司汀：20 mg。

地芬尼多 [基（基），保（甲）]

Difenidol

【适应证】用于防治多种原因或疾病所引起的眩晕、恶心、呕吐，如乘车、船、飞机时的晕动病等，也用于椎基底动脉供血不足、梅尼埃病等。

【注意事项】(1) 肾功能不全者、妊娠期妇女、青光眼、胃溃疡、胃肠道及泌尿生殖道梗阻性疾病者、窦性心动过速者慎用。(2) 用于预防晕动病或用于预防乘车、坐船、飞机等眩晕时，应在出发前 30 分钟服用。(3) 如服用过量、出现精神紊乱者或严重不良反应者，请立即停药，及时就医。

【禁忌证】对本品过敏者及 6 个月以内婴儿禁用。严重肾功能不全的患者禁用。

【不良反应】常见口干、心悸、头晕、头痛、嗜睡、不安、心动过速、视物模糊、轻度胃肠不适，停药后即可消失；偶见幻听、幻视、定向力障碍、精神错乱、忧郁、皮疹、一过性低血压反应。

【用法与用量】(1) 口服：一次 25 ～ 50 mg 一日 3 次，6 个月以上小儿按体重一次 0.9 mg/kg，一日 3 次，12 岁以下儿童用量请咨询医师或药师。(2) 肌内注射：一次 20 ～ 40 mg，一日 4 次。

【制剂与规格】盐酸地芬尼多片：① 25 mg；② 50 mg。

盐酸地芬尼多注射液：1 ml ：10 mg。

长春西汀 [保（乙）]

Vinpocetine

【适应证】用于改善脑梗死后遗症、脑出血后遗症、脑动脉硬化症等诱发的各种症状。

【注意事项】(1) 本品不可静脉或肌内注射。(2) 输液中长春西汀的浓度不得超过 0.06 mg/ml，否则有溶血的可能。(3) 本品含山梨醇，糖尿病患者应用时注意。(4) 哺乳期妇女慎用，必须使用时应停止哺乳。

【禁忌证】对本品过敏者、颅内出血后尚未完全止血者、严重缺血性心脏病者、严重心律失常者、孕妇或已有妊娠可能的妇女禁用。

【不良反应】可出现皮疹，偶见荨麻疹、瘙痒、头痛、眩晕、困倦感、侧肢的麻木感、脱力感加重；恶心、呕吐、食欲缺乏、腹痛、腹泻、面部潮红、头晕、白细胞减少、AST 及 ALT、碱性磷酸酶升高血尿素氮升高。

【用法与用量】静脉滴注：开始剂量一日 20 mg，以后根据病情可增至一日 30 mg。将本品加入 500 ml 输注液内，缓慢滴注。

【制剂与规格】长春西汀注射液：2 ml ：20 mg。

法舒地尔[保(乙)]

Fasudil

【适应证】用于改善蛛网膜下腔出血后脑血管痉挛等引起的缺血性脑血管疾病症状。

【注意事项】(1) 本品只可静脉滴注使用，不可脊髓腔内注入本品。(2) 本品使用时，应密切注意临床症状及 CT 改变，若发现颅内出血，应立即停药并进行适当处理。(3) 本品可引起低血压，应注意血压变化及给药剂量和速度。(4) 严重意识障碍患者，蛛网膜下腔出血合并重症脑血管损害，如脑底异常血管网或巨大脑动脉瘤等患者、70 岁以上患者应慎用。

【禁忌证】(1) 正在出血的患者，尤其颅内出血的患者和低血压患者禁用本品。(2) 妊娠或可能妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 可引起低血压、面部潮红、反射性心动过速及出血。(2) 应用本品有时发生 AST 及 ALT 升高，有时出现皮疹、排尿困难或多尿、嗳气、呕吐，并可出现头痛、发热、意识水平下降和呼吸抑制等。

【用法与用量】静脉滴注：成人一次 30 mg，一日 2 ~ 3 次，以适量的电解质液稀释后静脉滴注，每次 30 分钟。本品给药应在蛛网膜下腔出血术后早期开始，连用 2 周。

【制剂与规格】盐酸法舒地尔注射液：2 ml ：30 mg。

丁咯地尔[保(乙)]

Buflomedil

【适应证】(1) 外周血管疾病：间歇性跛行、雷诺综合征、血栓闭塞性脉管炎等。(2) 慢性脑血管供血不足引起的症状：眩晕、耳鸣、智力减退、记忆力或注意力减退、定向障碍等。

【注意事项】(1) 丁咯地尔使用有一定的危险性，不能超过最大用量使用。(2) 肝肾功能不全患者慎用，必须使用本品时应减少剂量或遵医嘱。(3) 由于本品通过肾脏排泄，因此使用前必须检查肌酐清除率，使用中进行定期检查：①肾功能正常者至少每年检查 1 次；②肌酐清除率低于正常的患者、65 岁以上和体重不足 50 kg 患者至少每年 2 次。(4) 正在服用降压药患者慎用。(5) 本品可引起头晕、嗜睡等症状，驾驶车辆及操作机械者不宜服用本品。(6) 老年用药未进行相关试验且无可靠参考文献。

【禁忌证】(1) 对本品中任何成分过敏者。(2) 急性心肌梗死、心绞痛、甲状腺功能亢进、阵发性心动过速者。(3) 脑出血及有出血倾向或近期有大量失血者；分娩后产妇和严重动脉出血的患者。(4) 严重肾功能不全者（肌酐消除率小于每分钟 30 ml）。(5) 孕妇（尤其是妊娠 3 个月孕妇）、哺乳期妇女及儿童禁用。

【不良反应】常见胃肠不适、头痛、头晕和四肢皮肤刺痛灼热感等。过量使用或肾功能不全者使用会导致严重的神经和心血管不良反应。神经系统不良反应有痉挛、癫痫发作、肌阵挛等。心血管系统的不良反应有心动过速、低血压、心律失常、血液循环停止。

【用法与用量】本品使用有一定的危险性，必须考虑患者的肾功能情况使用，并严格遵守下列使用方法。(1) 口服：肾功能正常者，一日 300 ~ 600 mg，至少分 2 次服用，一日最多不可超过 600 mg；轻度和中度肾功能不全者（肌酐消除率为每分钟 30 ~ 80 ml），用量须减半，一次 150 mg，早晚各 1 次，一日用量不得超过 300 mg。(2) 肌内注射：一次 50 mg，一日 3 次，连续 14 日为 1 个疗程。(3) 静脉滴注：一次 0.2 ~ 0.4 g，稀释于 5% 葡萄糖或氯化钠注射液 250 ml 中，缓慢滴注。

【制剂与规格】盐酸丁咯地尔片：0.15 g。

盐酸丁咯地尔注射液：5 ml ：50 mg。

川芎嗪[保(乙)]

Ligustrazine

【适应证】用于闭塞性脑血管疾病如脑供血不足、脑血栓形成、脑栓塞。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女

慎用。(2) 对少量出血与闭塞性脑血管病鉴别诊断。(3) 不适于大剂量肌内注射。静脉滴注速度不宜过快。

【禁忌证】脑出血及有出血倾向者，对本品过敏者。

【不良反应】本品酸性较强，穴位注射刺激性较强。

【用法与用量】静脉滴注：以本品 40 ~ 80 mg，稀释于 5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液 250 ~ 500 ml 中静脉滴注。速度不宜过快，一日 1 次，10 日为 1 个疗程，一般使用 1 ~ 2 个疗程。

【制剂与规格】磷酸川芎嗪注射液：50 mg。

盐酸川芎嗪注射液：40 mg ：2 ml。

丹参酮ⅡA [保(乙)]

Tanshinon ⅡA

【适应证】用于冠心病、心绞痛、心肌梗死的辅助治疗。

【注意事项】妊娠期尤其是妊娠初始 3 个月内妇女、哺乳期妇女避免使用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】部分患者于肌内注射后有疼痛，个别有皮疹反应，停药后即可消失。

【用法与用量】(1) 肌内注射：一次 40 ~ 80 mg，一日 1 次。(2) 静脉注射：一次 40 ~ 80 mg，以 25% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释。(3) 静脉滴注：一次 40 ~ 80 mg，以 5% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 稀释，一日 1 次。

【制剂与规格】丹参酮Ⅱ A 磺酸钠注射液：2 ml ：10 mg。

葛根素 [保(乙)]

Puerarin

【适应证】用于辅助治疗冠心病、心绞痛、心肌梗死、视网膜动静脉阻塞、突发性聋及缺血性脑血管病、小儿病毒性心肌炎、糖尿病等。

【注意事项】(1) 血容量不足者应在短期内补足血容量后使用本品。(2) 有出血倾向者慎用。

【禁忌证】严重肝肾损害、心力衰竭及其他严重器质性疾病患者禁用。

【不良反应】少数患者在用药开始时出现暂时性腹胀、恶心等反应，继续用药可自行消失；极少数患者用药后有皮疹、发热等过敏现象，立即停药或对症治疗后，可恢复正常。

【用法与用量】静脉滴注：一次 0.2~0.4 g，加入葡萄糖注射液 500 ml 中，一日 1 次，10 ~ 20 日为 1 个疗程，可连续使用 2 ~ 3 个疗程。

【制剂与规格】葛根素注射液：2 ml：100 mg。

阿魏酸钠 [保(乙)]

Sodium Ferulate

【适应证】用于动脉粥样硬化、冠心病、脑血管病、肾小球疾病、肺动脉高压、糖尿病性血管病变、脉管炎等血管性病症的辅助治疗，亦可用于偏头痛、血管性头痛。

【注意事项】儿童、孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶有过敏性皮疹反应，停药后即消失。

【用法与用量】口服。用于偏头痛、血管性头痛，一次 50 ~ 100 mg，一日 3 次。用于冠心病、脑血管病、脉管炎和血小板减少症，一次 20 ~ 100 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】阿魏酸钠片：50 mg。

曲克芦丁 [保(乙)]

Troxerutin

【适应证】本品有防止血管通透性异常升高引起的水肿，抑制红细胞及血小板凝集，改善微循环等作用。可用于闭塞性脑血管病、中心性视网膜炎、动脉硬化、冠心病、梗死前综合征、血栓性静脉炎，慢性静脉功能不全所致的静脉曲张。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 服药期间避免阳光直射、高温及过久站立。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】偶见有胃肠道反应，表现为恶心、呕吐及便秘。

【用法与用量】口服：一次 120 ~ 180 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】曲克芦丁片：60 mg。

尼麦角林[保(乙)]

Nicergoline

【适应证】慢性下肢闭塞性动脉病引起的间歇性跛行的辅助治疗，由于改善某些老年人病理性智力减退的症状，用于有头晕感的老年人。

【注意事项】(1) 肾功能不全者应减量。(2) 妊娠期妇女慎用。(3) 慎用于高尿酸血症者或有痛风史者。(4) 通常在治疗剂量时对血压无影响，但对敏感患者可能会逐渐降低血压。(5) 服药期间禁止饮酒。

【禁忌证】近期心肌梗死、急性出血、严重的心动过缓、直立性调节功能障碍、出血倾向和对尼麦角林过敏者。

【不良反应】常见低血压、头晕、胃痛、潮热、面部潮红、嗜睡、失眠等、突然的直立性血管舒张性阵热或头晕。

【用法与用量】(1) 口服：一日 30 mg，早晨服用。智力衰退和有头晕感的老年人，每早 30 mg 或遵医嘱。(2) 静脉滴注：一次 2 ~ 4 mg，溶于氯化钠注射液 100 ml 中缓慢滴注，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】尼麦角林片：① 10 mg；② 30 mg。

尼麦角林胶囊：30 mg。

注射用尼麦角林：4 mg。

双氢麦角毒碱(二氢麦角碱)[保(乙)]

Dihydroergotoxine

【适应证】(1) 主要用于脑动脉硬化、脑卒中后遗症、脑震荡后遗症、老年人退化性脑循环障碍及老年痴呆等疾病引起的头痛、头晕、眩晕、记忆力下降、注意力不集中、定向力障碍、情绪不安、抑郁、孤僻、疲劳感、轻度精神错乱、食欲缺乏等。(2)用于周围血管疾病，如雷诺综合征、血栓闭塞性脉管炎、动脉内膜炎、糖尿病引起的微循环障碍等，及其引起的间歇性跛行、手足发绀、冻疮、动脉硬化、肢端动脉痉挛、动脉血栓栓塞、血管性头痛等。(3) 用于高血压，仅适用于以下患者（因本药降压作用轻微）：老年患者、脑动脉硬化及脑卒中患者、服用利尿药降压无效者（可与本药联用）。

【注意事项】(1) 心率稍慢者慎用。(2) 老年人应适当调整给药剂量。(3) 孕妇不宜使用本药。(4) 本药可能会抑制乳汁分泌，不建议哺乳期妇女使用。

【禁忌证】(1) 对本药过敏者。(2) 急慢性精神病患者。(3) 低血压、严重的动脉硬化、严重心动过缓、心脏器质性损害者。(4) 严重肝、肾功能不全者。

【不良反应】(1) 中枢神经系统：失眠、眩晕等，极少患者可出现视物模糊，罕见耳鸣。(2) 心血管系统：①心动过缓。②血管收缩。偶见血管痉挛和血栓栓塞并发症。③严重者可出现直立性低血压。④罕见心前区疼痛。(3) 胃肠道：可见口干、口腔炎、恶心、呕吐、腹胀、腹痛、便秘、畏食、胃灼热，少数病人可出现舌感觉异常。(4) 呼吸系统：鼻塞、鼻充血、呼吸道分泌物增多、呼吸困难等，罕见鼻狭窄。(5) 肝：ALT、AST 升高。(6) 泌尿系统：可引起肾病发作。(7) 皮肤：可见皮疹、面部潮红，罕见瘙痒等过敏反应。

【用法与用量】(1) 口服：①片剂，一次 1 ~ 2 mg，一日 3 次，12 周为 1 个疗程。②缓释胶囊，一次 2.5 mg，一日 2 次，于早、晚进餐时服用。(2) 舌下给药：含片，一次 0.5 ~ 2 mg，每 4 ~ 6 小时 1 次。(3) 肌内注射：一次 0.3 ~ 0.6 mg，一日 1 次或隔日 1 次。(4) 皮下注射：同肌内注射。(5) 静脉注射：一次 0.3 mg，用 20 ml 葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释后静脉注射，一日 1 ~ 2 次。(6) 静脉滴注：一次 0.3 mg，用 5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液 250 ml 或 500 ml 稀释后静脉滴注，一日 2 次。

【制剂与规格】甲磺酸双氢麦角毒碱片：① 1 mg；② 1.5 mg。

甲磺酸双氢麦角毒碱含片：① 0.25 mg；② 0.5 mg。

甲磺酸双氢麦角毒碱舌下含片：① 0.5 mg；② 1 mg。

甲磺酸双氢麦角毒碱缓释胶囊：2.5 mg。

甲磺酸双氢麦角毒碱注射液：1 ml : 0.3 mg。

银杏叶提取物

Ginkgo Biloba Leaf Extract

【适应证】主要用于脑部、周边等血液循环障碍，如急慢性脑功能不全及其后遗症如脑卒中、注意力不集中、记忆力衰退、痴呆。耳部血流及神经障碍如耳鸣、眩晕、听力减退、耳迷路综合征。眼部血流及神经障碍如糖尿病引起的视网膜病变及神经障碍、老年黄斑变性、视物模糊、慢性青光眼。末梢循环障碍如各种动脉闭塞症、间歇性跛行症、手脚麻痹冰冷、四肢酸痛。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 高乳酸血症、甲醇中毒者、果糖、山梨醇耐受性不佳者及 1，6- 二磷酸果糖酶缺乏者，给药剂量一次不可超过 25 ml。

【禁忌证】对过敏体质者不建议使用此药。

【不良反应】(1) 罕见胃肠道不适、头痛、血压降低、过敏反应等现象。(2) 长期静脉注射时，应改变注射部位以减少静脉炎的发生。

【用法与用量】(1) 口服：一次 80 mg，一日 3 次或遵医嘱。(2) 静脉滴注：一次 35 ~ 70 mg，一日 1 ~ 2 次；若必要时可视情况调整剂量至一次 87.5 mg，一日 2 次。病情改善缓和后，可改以片剂或滴剂口服给药。注射液静脉给药时可添加于氯化钠注射液、葡萄糖注射液或低分子右旋糖酐输液中，混合比例为 1 : 10。若输液为 500 ml，静脉滴注速度应控制在 2 ~ 3 小时。

【制剂与规格】银杏叶片：大多数为 40 mg（内含总黄酮醇 9.6 mg、萜类内酯 2.4 mg）。

银杏叶提取物注射液：5 ml : 17.5 mg。

罂粟碱 [保(乙)]

Papaverine

【适应证】用于治疗脑、心及外周血管痉挛所致的缺血，肾、胆、胃肠道等内脏痉挛。

【注意事项】(1) 用药期间出现肝功能不全时应即停药。(2) 新近出现的心肌梗死、心功能不全及心肌抑制、脑卒中及青光眼患者慎用。(3) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(4) 用药期间需检查肝功能，尤其是患者有胃肠道症状或黄疸时。(5) 青光眼患者应定期监测眼压。(6) 静脉注射时应充分稀释后缓慢注射（不少于 1 ~ 2 分钟），以避免导致房室传导阻滞、心室颤动，甚至死亡。(7) 静脉输注本品时，如果颅内压明显升高，应减少用量。

【禁忌证】对本品过敏者；完全性房室传导阻滞、帕金森病者、颅内高压者禁用。

【不良反应】(1) 可因肝功能受损而出现黄疸（表现为眼及皮肤黄染等），ALT、AST、胆红素增高，嗜酸粒性细胞增多。(2) 有胃肠道不适、恶心、呕吐、食欲缺乏、便秘、头痛、嗜睡等。(3) 胃肠道外给药可引起注射部位红肿或疼痛。注射过快可出现呼吸加深、面色潮红、心跳加快、低血压伴眩晕等，严重时可致房室传导阻滞、心室颤动，甚至死亡。

【用法与用量】(1) 肌内注射：一次 30 mg，一日 90 ~ 120 mg。(2) 静脉注射：一次 30 ~ 120 mg，每间隔 3 小时 1 次。缓慢注射，时间不少于 1 ~ 2 分钟。用于心脏停搏时，两次给药应间隔 10 分钟。

【制剂与规格】盐酸罂粟碱片：30 mg。

罂粟碱肠溶片：100 mg。

盐酸罂粟碱注射液：30 mg。

胞磷胆碱 [基(基)，保(甲)]

Citicoline

【适应证】用于急性颅脑外伤和脑手术后意识障碍，也用于急性中毒、感染、大面积脑梗死所致的昏迷和意识障碍、帕金森病、急性胰腺炎，也有助于脑卒中后遗症、卒中偏瘫者上、下肢体功能的恢复。

【注意事项】(1) 对急性重症，严重脑水肿、头部外伤及脑手术所伴意识障碍者，应同时使用止血、降颅内压药及低温疗法处理。(2) 若颅内出血仍然存在，应避免给予大剂量（一次 > 500 mg），因其可加速大脑血流，建议给予较小剂量（一次 100 ~ 200 mg，1 日 2 ~ 3 次）。(3) 对脑梗死急性期意识障碍者，应在脑卒中发作后 2 周内给药。(4) 尽量少用肌内注射，特别不宜在同一部位反复注射。当注射出现剧痛时应立即拔出，改换部位。静脉给

药的速度应尽量缓慢。(5) 用药中若出现胸闷、血压下降、呼吸困难等反应，应立即停药。

【禁忌证】对过敏者禁用。偶可诱发癫痫大发作，对有癫痫史者禁用或慎用。

【不良反应】(1) 中枢神经系统：偶见有失眠、发热、头痛、眩晕、兴奋、痉挛等；罕见一过性复视。用于脑卒中偏瘫时，偶见麻痹肢体出现麻木感。(2) 消化系统：偶见有恶心；罕见食欲减退等。(3) 循环系统：罕见休克症状，若出现血压下降、胸闷、呼吸困难等应立即停药。罕见一过性血压变化。(4) 偶见肝功能监测值异常。

【用法与用量】(1) 静脉注射或肌内注射：用于脑外伤，一次 100 ~ 500 mg，一日 1 ~ 2 次。(2) 静脉滴注：用于脑梗死急性期一次 1000 mg，一日 1 次，应用 5% ~ 10% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释后滴注，连用 2 周；用于偏瘫，一日 250 ~ 1 000 mg，连用 4 周，如出现改善倾向再继续用药 4 周；用于帕金森病，一日 500 mg，连用 3 ~ 4 周，若与抗胆碱药连续并用达 2 周仍未见效应停药；用于急性胰腺炎一日 1 000 mg，连用 2 周。

【制剂与规格】胞磷胆碱注射液：① 2 ml : 100 mg；② 2 ml : 200 mg；③ 2 ml : 250 mg。

注射用胞磷胆碱钠：250 mg。

吡硫醇[保(乙)]

Pyritinol

【适应证】用于改善脑外伤后遗症、脑炎及脑膜炎后遗症等的头晕胀痛、失眠、记忆力减退、注意力不集中、情绪变化，及脑动脉硬化或老年痴呆性精神症状。

【注意事项】肝功能不全患者慎用。滴注速度不宜过快，不能静脉快速注射。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。因动物实验有引起第二代动物唇裂的倾向，哺乳期妇女禁用。

【不良反应】偶见皮疹、恶心等，停药后即可恢复。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 3 次；儿童一次 0.05 ~ 0.1 g，一日 3 次。(2) 静脉滴注：一日 0.2 ~ 0.4 g。临用前，用适量注射用水溶解后，加入 5% 或 10% 葡萄糖注射液 500 ~ 1 000 ml 中滴注。

【制剂与规格】盐酸吡硫醇片：① 100 mg；② 200 mg。

注射用盐酸吡硫醇：0.2 g。

甲氯芬酯[保(乙)]

Meclofenoxate

【适应证】用于改善脑出血、脑手术、脑外伤、脑动脉硬化引起的意识障碍。也可用于老年痴呆、慢性记忆障碍、抑郁症、小儿智力发育迟钝及小儿遗尿症等。

【注意事项】高血压患者慎用。

【禁忌证】 精神过度兴奋、锥体外系症状患者及对本品过敏者。

【不良反应】胃部不适、兴奋、失眠、倦怠、头痛等。

【用法与用量】口服：成人一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 3 次，至少服用 1 周；儿童一次 0.1 g，一日 3 次，至少服用 1 周。

【制剂与规格】盐酸甲氯芬酯胶囊：0.2 g。

吡拉西坦[保(乙)]

Piracetam

【适应证】适用于脑外伤、脑动脉硬化、脑血管病等多种原因所致的记忆及思维功能减退。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女慎用。(2) 老年人、大多数外科术后者，有严重出血倾向及肝肾功能不全者慎用。(3) 避免突然停药。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠期妇女、新生儿禁用。

【不良反应】(1) 常见恶心、腹部不适、食欲减退、腹胀、兴奋、易激动、头晕和失眠等。(2) 偶见轻度肝功能损害，表现为轻度 ALT 及 AST 升高。还有体重增加、幻觉、共济失调、皮疹。

【用法与用量】(1) 口服：一次 0.8 ~ 1.6 g，一日 3 次，4 ~ 8 周为 1 个疗程。儿童用量减半。(2) 静脉滴注：一次 8 g，一日 1 次或遵医嘱。

【制剂与规格】吡拉西坦片：0.4 g。

吡拉西坦氯化钠注射液：250 ml :

8 g。

阿米三嗪萝巴新[保（乙）]

Almitrine and Raubasine

【适应证】治疗老年人认知和慢性感觉神经损害的有关症状（不包括阿尔茨海默病和其他类型的痴呆）；血管源性视觉损害和视野障碍的辅助治疗；血管源性听觉损害、眩晕和（或）耳鸣的辅助治疗。

【注意事项】(1) 周围神经病变：在长期治疗中，曾报告有周围神经病变的发生，患有周围神经病变的患者应慎用。当下肢出现或持续存在感觉异常应停止治疗。(2) 可能伴有体重减轻，无法解释的体重减轻超过5%时，应停止治疗。(3) 由于服药后可出现嗜睡和头晕，应避免驾驶和操作机械。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肝功能损害者。

【不良反应】体重减轻，周围神经病变，肠胃不适、恶心、上腹部烧灼感、消化不良、排空障碍、失眠、嗜睡、激动、焦虑、头晕、心悸、头痛、腹泻。

【用法与用量】口服：一次1片，一日2次，一日不可以超过2片，用半杯水整片吞服且不要嚼碎。

【制剂与规格】甲磺酸阿米三嗪萝巴新：每片含甲磺酸阿米三嗪30 mg、萝巴新10 mg。

茴拉西坦[保（乙）]

Aniracetam

【适应证】中老年记忆减退；脑血管病后的记忆减退。

【注意事项】(1) 肝功能异常者应适当调整剂量。(2) 儿童、孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者或对其他吡咯烷酮类不耐受者。

【不良反应】常见口干、食欲减退、便秘、头晕、嗜睡、全身皮疹。

【用法与用量】口服。一次0.2 g，一日3次。

【制剂与规格】茴拉西坦片：50 mg。

茴拉西坦胶囊：100 mg。

茴拉西坦口服液：① 10 ml：100 mg；② 10 ml：200 mg。

奥拉西坦

Oxiracetam

【适应证】主要用于轻中度血管性痴呆、老年性痴呆及脑外伤等引起的记忆与智能障碍。

【注意事项】(1) 儿童、妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 老年人用药期间如出现不良反应须减量。(3) 如患者出现精神兴奋和睡眠紊乱时应酌减剂量。

【禁忌证】对本品过敏者及严重肾功能不全者。

【不良反应】偶见恶心、前胸和腹部有发热感、肝肾功能异常等不良反应。

【用法与用量】(1) 口服：一次800 mg，一日2～3次。(2) 静脉滴注：一次4 g，一日1次。加入5%葡萄糖注射液100～250 ml或0.9%氯化钠注射液100～250 ml中，神经功能缺失疗程为2周，记忆与智能障碍疗程为3周。

【制剂与规格】奥拉西坦胶囊：①400 mg；② 800 mg。

奥拉西坦片：① 200 mg；② 400 mg；③ 800 mg。

奥拉西坦注射液：5 ml：1 g。

依达拉奉[保（乙）]

Edaravone

【适应证】依达拉奉是一种脑保护药，可清除自由基，抑制脂质过氧化，从而抑制脑细胞、血管内皮细胞和氧化损伤。用于脑梗死，改善急性脑梗死所致的神经症状、日常生活能力和功能障碍。

【注意事项】(1) 因有加重急性肾功能不全或肾衰竭的病例报道，因此在给药过程中应进行多次肾功能检测，同时结束后继续密切观察，如出现肾功能下降的表现或少尿等症状，应立即停药，进行适当处理。(2) 本品须用氯化钠注射液稀释（与各种含糖注射液混合时，可使依达拉奉的浓度降低）。不可与高能量输液、氨基酸注射剂混合或由同一容器内静脉滴注（混合后可致本品的浓度降低）。(3) 与抗癫痫药（地西泮、苯妥英钠等）和坎利酸钾混合可产生浑浊。

【不良反应】常见肝功能异常、皮疹、AST 及 ALT 升高。

【禁忌证】重度肾衰竭者（有致肾衰竭加重的可能）禁用；有过敏史的患者禁用。与头孢唑啉、哌拉西林、头孢替安等抗生素合用时，有加重肾衰竭的可能，因此合并用药时需多次进行肾功能监测。

【用法与用量】静脉滴注：一次 30 mg，一日 2 次，稀释于氯化钠注射液 100 ~ 250 ml 静脉滴注，于 30 分钟内滴毕，连续 14 日为 1 个疗程，并尽可能在发病 24 小时内开始用药。

【制剂与规格】依达拉奉注射液：5 ml ∶ 10 mg。

丁苯酞[保(乙)]

Butylphthalide

【适应证】用于轻、中度急性缺血性脑卒中。

【注意事项】(1) 于餐后服用可影响药物吸收，建议餐前服用本品。(2) 肝、肾功能受损者慎用。(3) 在用药过程中需注意监测肝功能变化。(4) 因本品尚未进行出血性脑卒中临床研究，故不推荐出血性脑卒中患者使用。(5) 有精神症状或有幻觉者慎用。对吞咽功能障碍者不宜服用。(6) 本品用于妊娠及哺乳期妇女的安全性尚不明确。

【禁忌证】对本品或芹菜过敏者禁用。有严重出血倾向者禁用。

【不良反应】本品不良反应较少，主要为 ALT 及 AST 轻度升高，根据部分随访观察的病例，停药后可恢复正常；偶见恶心、腹部不适、皮疹及精神症状等。

【用法与用量】口服：一次 0.2 g，一日 4 次，空腹服用，连续 10 ~ 12 日为 1 个疗程，或遵医嘱。本品应与复方丹参注射液联合使用。

【制剂与规格】丁苯酞软胶囊：0.1 g。

1.1.2 出血性脑血管病及其用药

1.1.2.1 脑出血的药物治疗

（1）对症支持治疗。

（2）控制血压：脑出血（cerebral hemorrhage）患者血压的控制尚无统一标准，应视患者的年龄、既往有无高血压、有无颅内压增高、出血原因、发病时间等情况而定。一般可遵循下列原则。

①对脑出血患者不要急于降血压，因为其血压升高是对颅内压升高的一种反射性自我调节；应先降颅内压后，再根据血压情况决定是否进行降血压治疗。

② 血压 ≥ 200/110 mmHg 时，在降颅压的同时可慎重平稳降血压治疗，使血压维持在略高于发病前水平或 180/105 mmHg 左右；收缩压在 170 ~ 200 mmHg 或舒张压 100 ~ 110 mmHg，暂时尚可不必使用抗高血压药，先行脱水降颅压，并严密观察血压情况，必要时再用抗高血压药。血压降低幅度不宜过大，否则可能造成脑低灌注。收缩压 < 165 mmHg 或舒张压 <95 mmHg，不需降血压治疗。

③血压过低者应升压治疗，以保持脑灌注压。

（3）降低颅内压：颅内压升高是脑出血患者死亡的主要原因，因此降低颅内压为治疗脑出血的重要任务。适当限制液体入量、防治低钠血症、过度换气等都有助于降低颅内压。药物降颅压治疗首先以高渗脱水药为主，如甘露醇或甘油果糖、甘油氯化钠等，注意尿量、血钾及心肾功能。可酌情选用呋塞米、白蛋白。

（4）止血药一般不用，若有凝血功能障碍，可应用，但时间不超过 1 周。

（5）手术治疗：手术目的主要是尽快清除血肿、降低颅内压、挽救生命，其次是尽可能早期减少血肿对周围脑组织的压迫，降低致残率。一般来说，出血量在 20 ~ 80 ml 者可于超早期、早期或急性期行脑室内或血肿腔内穿刺，并以尿激酶（见 1.1.1.2）灌注。

1.1.2.2 蛛网膜下腔出血的药物治疗

（1）对症支持，保持生命体征稳定：烦躁者给予镇静药，头痛予给镇痛药，注意慎用阿司匹林等可能影响凝血功能的非甾体抗炎镇痛药或吗啡、哌替啶等可能影响呼吸功能的药物。痫性发作时可短期应用抗癫痫药如地西泮、卡马西平或丙戊酸钠。

（2）降低颅内压：同脑出血降颅压

治疗。

(3) 防止再出血：①绝对卧床4～6周，镇静、镇痛，避免用力和情绪刺激。②调控血压：去除疼痛等诱因后，如果平均动脉压 >125 mmHg 或收缩压 >180 mmHg，可在血压监测下使用短效抗高血压药使血压下降，保持血压稳定在正常或者起病前水平。可选用钙通道阻滞药、β 受体拮抗药或 ACEI 类等。

(4) 抗纤维蛋白溶解药：可防止动脉瘤周围的血块溶解引起再度出血，以抑制纤溶酶的形成。常用氨基己酸，初次剂量 4～6 g，溶于氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 100 ml 中静脉滴注(15～30 分钟)后一般维持静脉滴注一小时 1 g 或一日 2～24 g，使用 2～3 周或到手术前；也可用氨甲苯酸或氨甲环酸。抗纤溶治疗可以降低再出血的发生率，但同时也增加脑血管痉挛和脑梗死的发生率，建议与钙通道阻滞药同时使用。

(5) 防治脑动脉痉挛及脑缺血：①维持正常血压和血容量。血压偏高时可给予降压治疗；在动脉瘤处理后，血压偏低者，首先应去除诱因，如减少或停用脱水药和抗高血压药；给予胶体溶液（白蛋白、血浆等）扩容升压；必要时使用升压药如多巴胺静脉滴注。②早期使用尼莫地平（见 1.1.4）。常用剂量一日 10～20 mg，静脉滴注每小时 1 mg，共 10～14 日，注意其低血压的不良反应。

(6) 防治脑积水：轻度的急、慢性脑积水都应先行药物治疗，给予乙酰唑胺（见 13.5.4）等药物减少 CSF 分泌，酌情选用甘露醇、甘油果糖、呋塞米（见 4.6.2）等。必要时可考虑外科干预。呋塞米与其他药物合用治疗急性肺水肿和急性脑水肿等。口服：起始一日 1 次，一次 20～40 mg，以后根据需要可增至一日 60～120 mg，分 3～4 次。最大剂量可达一日 600 mg。静脉注射：开始一次 20～40 mg，每小时或每 2 小时增加剂量。一日总剂量不超过 1 g。可将 200～400 mg 加入 0.9% 氯化钠注射液 100 ml，每分钟不超过 4 mg。

甘露醇 [基(基)，保(甲)]

Mannitol

【适应证】用于各种原因引起的脑水肿，降低颅内压，防止脑疝。

【注意事项】(1) 心功能不全、低血容量者、高钾血症或低钠血症者慎用。(2) 应严格掌握适应证，对于眼压非显著增高者、年龄较大者可尽量不用，对肾功能损害或有潜在疾病者，应避免或减量使用。(3) 过敏体质者尽量不用，如必须使用，可先给予地塞米松 10 mg 静脉注射，并严密观察。(4) 使用本品的时间不宜过长，剂量不宜过大。(5) 使用本品过程中应注意水和电解质平衡，密切观察肾功能。(6) 老年人使用本品较易出现肾损害，应适当控制用量。(7) 孕妇、哺乳期妇女及儿童慎用。(8) 明显肾功能损害者、高钾血症或低钠血症、低血容量患者慎用。

【禁忌证】有活动性脑出血、急性肾小管坏死或慢性肾衰竭、严重失水者、急性肺水肿者。

【不良反应】常见水和电解质紊乱、寒战、发热、排尿困难、血尿、血栓性静脉炎、皮疹、荨麻疹、呼吸困难、过敏性休克、头晕、视物模糊、口渴、渗透性肾病。

【用法与用量】静脉滴注：成人一般选用 20% 溶液 250～500 ml（含 50～100 g），滴注时间控制在 30～60 分钟。

【制剂与规格】甘露醇注射液：① 50 ml : 10 g；② 250 ml : 50 g；③ 100 ml : 20 g。

甘油果糖注射液 [保(甲)]

Glycerol and Fructose Injection

【适应证】脑血管病、脑外伤、脑肿瘤、颅内炎症及其他原因引起的急慢性颅内压增高、脑水肿等。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 严重循环功能障碍、尿崩症、糖尿病、溶血性贫血者慎用；有严重活动性颅内出血无手术条件时慎用。(3) 儿童、老年人慎用。(4) 急性硬膜下、硬膜外血肿出血应在明确不出血时应用。(5) 使用本品应注意氯化钠的摄入量。

【禁忌证】遗传性果糖耐受不良症、高钠血症，无尿、严重脱水者，对本品过敏者。

【不良反应】常见瘙痒、皮疹、头痛、恶心、口干、溶血。

【用法与用量】静脉滴注：一日1～2次，一次250～500 ml，250 ml滴注时间控制在1～1.5小时。

【制剂与规格】甘油果糖注射液：①250 ml；②500 ml（每1 ml中含甘油100 mg、果糖50 mg、氯化钠2.25 mg）。

七叶皂苷钠[保(乙)]

Sodium Aescinate

【适应证】脑水肿、创伤或手术所致肿胀，静脉回流障碍性疾病。

【注意事项】(1) 老年人、哺乳期妇女慎用。(2) 不宜用于儿童心脏手术后肿胀。(3) 选用较粗的静脉注射，切勿渗出血管外。(4) 如出现红肿，可用0.25%普鲁卡因注射液封闭或热敷。

【禁忌证】肾损伤、肾衰竭、肾功能不全，妊娠及对本品过敏者。

【不良反应】皮疹、注射部位局部疼痛，肿胀。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：一日按体重0.1～0.4 mg/kg或取本品5～10 mg溶于10%葡萄糖注射液或氯化钠注射液250 ml，一日极量为20 mg。疗程为7～10日。

【制剂与规格】注射用七叶皂苷钠：①5 mg；②10 mg；③15 mg。

氨基己酸 用于预防及治疗血纤溶蛋白溶解亢进引起的各种出血。静脉滴注：起始剂量为4～6 g，溶于100 ml液体，于15～30分钟滴毕，维持剂量为每小时1 g。(其他见6.4)

1.2 痴呆及其用药

痴呆（dementia）是一种以认知功能缺损为核心症状的获得性智能损害综合征。按病因可分为神经变性性痴呆[如阿尔茨海默病（Alzheimer's disease，AD）]、神经系统变性性疾病伴发痴呆、血管性痴呆、继发于其他疾病的痴呆。

本节主要叙述阿尔茨海默病。AD是老年人常见的神经系统变性疾病，是痴呆最常见的病因。临床特征为隐袭起病、进行性智能衰退，多伴有人格改变。目前已广泛应用的抗痴呆药有：乙酰胆碱酯酶抑制药，*N*-甲基-*D*-天（门）冬氨酸（NMDA）受体拮抗药等。

乙酰胆碱酯酶抑制药用于AD的治疗，尤其是轻中度AD的治疗。已证实这类药物可以改善认知功能。乙酰胆碱酯酶抑制药可能引发剂量依赖性胆碱能效应，故应从小剂量用起，并依据其反应和耐受性增加剂量。在临床应用的药物中，多奈哌齐是可逆的乙酰胆碱酯酶抑制药。加兰他敏（抗胆碱酯酶药）既是可逆的乙酰胆碱酯酶抑制药，也是烟碱性受体激动药。利斯的明是可逆的非竞争性的乙酰胆碱酯酶抑制药。我国用于临床的乙酰胆碱酯酶抑制药还有石杉碱甲。

美金刚是*N*-甲基-*D*-天（门）冬氨酸（NMDA）受体拮抗药，影响谷氨酸传递，用于治疗中到重度的阿尔茨海默病。

此外，用于AD的药物还有脑代谢改善剂如茴拉西坦、银杏叶提取物（见1.1.1.4）、5-HT受体拮抗药如金刚烷胺（见9.6.3）等，对认知功能障碍也有一定改善。

多奈哌齐[保(乙)]

Donepezil

【适应证】轻度或中度阿尔茨海默病痴呆症状。

【注意事项】(1) 轻中度肝功能不全者宜适当调整剂量。(2) 病窦综合征或其他室上性心脏传导阻滞，消化道溃疡者，哮喘、慢性阻塞性肺病者慎用。

【禁忌证】孕妇及对本品过敏者。

【不良反应】常见感冒症状、厌食、腹泻、呕吐、恶心、皮疹、瘙痒、幻觉、易激惹、攻击行为、晕厥、眩晕、失眠、胃肠功能紊乱、肌肉痉挛、尿失禁、头痛、疲劳、疼痛、意外伤害；少见癫痫、心动过缓、胃肠道出血、胃、十二指肠溃疡、血肌酸激酶浓度的轻微增高；罕见锥体外系症状、窦房传导阻滞、房室传导阻滞、

肝功能异常（包括肝炎）、潜在的膀胱流出道梗阻。

【用法与用量】口服：开始时一日睡前服用 5 mg，如需要 1 个月后可将剂量增加到最大为一日 10 mg。

【制剂与规格】盐酸多奈哌齐片：① 5 mg；② 10 mg。

利斯的明（卡巴拉汀）[保（乙）]

Rivastigmine

【适应证】轻、中度阿尔茨海默病痴呆的症状。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如胃或十二指肠溃疡（或溃疡易感者）、病态窦房结综合征、心脏传导阻滞、哮喘或慢性阻塞性肺病、癫痫、膀胱流出道梗阻、严重肝功能不全、孕妇及哺乳期妇女、儿童。(2) 如停药数日后再次服用，应从起始剂量重新开始服用。

【禁忌证】对本品及其他氨基甲酸衍生物过敏者及严重肝损害者。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、腹泻、消化不良、厌食、腹痛、眩晕、头痛、嗜睡、震颤、虚弱、乏力、兴奋、意识模糊、出汗、体重减轻；少见晕厥、抑郁、失眠；罕见胃或十二指肠溃疡、心绞痛、癫痫。(2) 非常罕见消化道出血、胰腺炎、心律失常、心动过缓、高血压、幻觉、锥体外系症状、皮疹。

【用法与用量】口服：起始剂量为一次 1.5 mg，一日 2 次，以后根据疗效和耐受每隔至少 2 周一次增加 1.5 mg，直到最高剂量为一次 6 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】利斯的明胶囊：① 1.5 mg；② 3 mg；③ 4.5 mg；④ 6 mg。

加兰他敏[保（乙）]

Galanthamine

【适应证】用于良性记忆障碍，提高患者指向记忆、联想学习、图像回忆、无意义图形再认及人像回忆等能力。对痴呆患者和脑器质性病变引起的记忆障碍亦有改善作用。

【注意事项】(1) 有消化性溃疡病史或同时使用非甾体抗炎药的患者慎用。(2) 中度肝脏损害的患者慎用，必要时应适当减量。(3) 中度肾脏损害的患者慎用，必要时应减量使用。

【禁忌证】(1) 对本品中任一成分过敏者。(2) 在麻醉的情况下。(3) 心绞痛和心动过缓的患者。(4) 严重哮喘或肺功能障碍的患者。(5) 重度肝脏损害者。(6) 重度肾脏损害者。(7) 机械性肠梗阻的患者禁用。

【不良反应】(1) 神经系统：常见疲劳、头晕眼花、头痛、发抖、失眠、梦幻。罕见张力亢进、感觉异常、失语症和动力功能亢进等。(2) 胃肠系统：腹胀、反胃、呕吐、腹痛、腹泻、厌食及体重减轻、消化不良等。(3) 心血管系统：可见心动过缓、心律不齐；罕见低血压。(4) 血液系统：可见贫血；偶见血小板减少症。(5) 内分泌和代谢系统：偶见血糖增高，曾有低钾血症的报道。

【用法与用量】(1) 口服：一次 5 mg，一日 4 次；3 日后改为一次 10 mg，一日 4 次或遵医嘱。(2) 肌内注射：一次 2.5～10 mg，一日 1 次，2～6 周为 1 个疗程。(3) 静脉注射：按体重 0.5 mg/kg，可迅速逆转注射氢溴酸东莨菪碱所致中枢抗胆碱作用。

【制剂与规格】氢溴酸加兰他敏片：5 mg。

氢溴酸加兰他敏注射液：① 1 ml : 1 mg；② 1 ml : 2.5 mg；③ 1 ml : 5 mg。

石杉碱甲[保（乙）]

Huperzine A

【适应证】良性记忆障碍，对痴呆患者和脑器质性病变引起的记忆障碍也有改善作用。

【注意事项】(1) 心动过缓、支气管哮喘者慎用。(2) 治疗应从小剂量开始，逐渐增量。

【禁忌证】癫痫、肾功能不全、机械性肠梗阻、心绞痛者。

【不良反应】偶见头晕、恶心、胃肠道不适、乏力、视物模糊。

【用法与用量】口服：一次 0.1～0.2 mg，一日 2 次，最大剂量一日 0.45 mg。

【制剂与规格】石杉碱甲片：0.05 mg。

美金刚[保(乙)]

Memantine

【适应证】中到重度阿尔茨海默病。

【注意事项】(1) 肌酐清除率在 10 ~ 60 ml/min 者，应减量至一日 10 mg，建议肌酐清除率小于每分钟 10 ml 的患者应避免使用本品。(2) 动物研究发现可能出现胎儿宫内发育迟缓，故孕妇慎用。(3) 癫痫患者、惊厥史患者慎用。

【禁忌证】过敏者，哺乳期妇女。

【不良反应】常见便秘、高血压、头痛、眩晕、嗜睡；少见呕吐、血栓、意识模糊、疲倦、幻觉、步态异常；非常罕见癫痫、胰腺炎、精神病反应、抑郁和自杀倾向。

【用法与用量】口服：起始剂量为每早 5 mg，每周增加 5 mg 直到达到最大剂量为一次 10 mg，一日 2 次；一旦剂量超过一日 5 mg，则应分 2 次服用。

【制剂与规格】盐酸美金刚片：10 mg。

1.3 帕金森病和相关疾病及其用药

帕金森病（Parkinson disease，PD）又称震颤麻痹症，是主要发生于中老年人的、原因未明的以静止性震颤、运动缓慢、肌肉强直及姿势平衡障碍为主要特征的神经变性性疾病。其发病机制是由于黑质多巴胺神经元丢失导致神经递质多巴胺减少 80% 以上，而出现帕金森病的典型症状。补充脑中多巴胺可以改善患者的运动症状，提高患者的生活质量。但目前的药物治疗只能改善症状，尚不能达到阻止疾病进展的目的。

疑诊为帕金森病的患者应转诊至专科医师进行确诊和治疗，每 6 ~ 12 个月应进行回顾诊断。

继发性帕金森综合征则是由明确病因如感染、药物、中毒、脑动脉硬化、外伤等引起。

帕金森叠加综合征（如进行性核上性麻痹和多系统萎缩等疾病）的表现与帕金森病相似，但抗帕金森病的药物治疗多无效。少部分患者症状可有轻度改善，但疗效不持久。

目前主张对于年龄 < 65 岁且认知功能正常者建议先使用多巴胺受体激动药，或也可用金刚烷胺和苯海索；年龄在 65 岁以上或认知功能减退者可直接使用左旋多巴制剂治疗。随着疾病的进展会用到两种以上抗帕金森病药。多数患者最终会服用左旋多巴，经过 2 ~ 5 年的左旋多巴治疗，近半数患者会逐步出现运动并发症。

一旦开始治疗，要告知患者药物的局限性（不能根治）和可能的不良反应。少数帕金森病者对药物疗效较差。

特别要注意的是，抗帕金森病药一定不能突然停药，因为有发生恶性神经阻滞药综合征的可能。

抗帕金森病药在中老年人会导致幻觉、谵妄等精神症状，故刚开始治疗时应以小剂量起始逐渐加量，以减少发生不良反应的机会。

1.3.1 帕金森病的药物治疗

抗帕金森病药主要有 6 大类：拟多巴胺类药（包括左旋多巴及其复方制剂），多巴胺受体激动药，单胺氧化酶-B 抑制药，儿茶酚-氧位-甲基转移酶抑制药，金刚烷胺及抗胆碱药。

1.3.1.1 拟多巴胺类药

本类药物包括左旋多巴及其与多巴胺脱羧酶抑制药的复方制剂。左旋多巴在体内可转化为多巴胺而起作用。左旋多巴治疗应从小量起始，逐步加量；维持量应尽量小。服药间隔应根据患者的需要。

建议先服用复方左旋多巴标准片，在出现剂末现象后再服用复方左旋多巴控释片。控释片 1 片的疗效弱于标准片，但疗效的持续时间较标准片长。即在换用控释片后，左旋多巴的剂量约需增加 25% 才能提供与标准片相似的疗效。一日剂量可根据患者的需要调整。建议空腹（餐前或餐后 1 小时）服用。因饮食中的蛋白质可减少药物的吸收，降低疗效。注意低蛋白饮食。

左旋多巴治疗 2 ~ 5 年后通常会出现难治的运动并发症包括运动波动和异动

症。运动波动表现为运动症状的巨大变化，“开”期运动功能正常，“关”期则无力和活动受限。还会发生“剂末现象”，表现为一次服药后维持时间缩短。缓释或控释剂型可能对“剂末现象”或夜间僵直有帮助。

左旋多巴常与多巴胺脱羧酶抑制药卡比多巴联合使用，因为后者可以抑制前者在外周转变为多巴胺，减少应用左旋多巴后的一些外周性不良反应。常用的此类复方制剂有多巴丝肼（左旋多巴与苄丝肼）以及左旋多巴-卡比多巴。对中老年或体弱者，合并其他重大疾病者，以及症状严重患者是很有益的。对大部分患者来讲，有效并且容易耐受。

服用左旋多巴-苄丝肼或左旋多巴-卡比多巴出现的恶心、呕吐罕见，从小剂量开始并逐渐加量可减少这种不良反应，服用多潘立酮也可以控制此效应。

服用左旋多巴-卡比多巴，左旋多巴-卞丝肼和多巴胺受体激动药都可以出现白天睡眠过多和发作性睡眠。在开始治疗时应告知患者会出现此不良反应，故在驾驶或操纵机器时应特别注意。当患者出现过度睡眠或发作性睡眠时应停止驾驶或操纵机器。

多巴丝肼[保（乙）]

Levodopa and Benserazide

【适应证】帕金森病，症状性帕金森综合征（非药物引起的锥体外系症状）。

【注意事项】(1) 有下列情况慎用，如肺疾病、消化性溃疡、心脏疾病、糖尿病、骨软化、开角型青光眼、闭角型青光眼易感者、黑素瘤、精神病（严重者应避免使用）、妊娠及哺乳期妇女。(2) 警示患者有过度嗜睡。(3) 长期治疗应监测精神状态，心、肝、肾功能及血常规。(4) 提示患者应逐渐开始正常活动，并避免突然停药。

【禁忌证】严重的内分泌、肾脏、肝脏、心脏病、精神病、闭角型青光眼、对本品过敏者及与非选择性单胺氧化酶抑制药类药合用者。

【不良反应】常见厌食、恶心、呕吐、三唑仑样反应、不安、直立性低血压（罕见不稳定性高血压）、眩晕、心动过速、心律不齐、尿或体液红染；罕见过敏、不自主运动、精神症状包括轻症躁狂和剂量相关性精神病、抑郁、嗜睡、头痛、潮红、出汗、消化道出血、周围神经病、味觉失常、性欲增高、性欲亢进、瘙痒、皮疹、肝药酶改变、神经阻滞药恶性综合征；非常罕见闭角型青光眼。

【用法与用量】口服：首次推荐量为一次 125 mg，一日 3 次。以后每周日剂量增加 125 mg。有效剂量为一日 500 ~ 1 000 mg，分 3 ~ 4 次服用。老年人起始剂量为一日 1 ~ 2 次，一次 50 mg，根据疗效每 3 ~ 4 日增加日剂量 50 mg。

【制剂与规格】多巴丝肼胶囊：① 125 mg（内含左旋多巴 100 mg、苄丝肼 25 mg）；② 250 mg（内含左旋多巴 200 mg、苄丝肼 50 mg）。

多巴丝肼片：① 125mg（内含左旋多巴 100 mg、苄丝肼 25 mg）；② 250 mg（内含左旋多巴 200 mg、苄丝肼 50 mg）。

多巴丝肼控释片：125 mg（内含左旋多巴 100 mg、苄丝肼 25 mg）。

多巴丝肼分散片：125 mg（内含左旋多巴 100 mg、苄丝肼 25 mg）。

卡比多巴左旋多巴

Carbidopa and Levodopa

【适应证】原发性帕金森病，脑炎后帕金森综合征，症状性帕金森综合征。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 严重心血管疾病、心律失常、近期心肌梗死、肺部疾病、支气管哮喘、肾病、肝病、内分泌疾病、消化系统溃疡、惊厥、开角型青光眼者慎用。(3) 18 岁以下儿童不宜使用。(4) 禁与非选择性单胺氧化酶抑制药类药品合用。

【禁忌证】闭角型青光眼、皮肤损伤或黑色素瘤。

【不良反应】常见运动障碍、恶心、幻觉、精神错乱、头晕、舞蹈病、口干；少见、肌张力障碍、嗜睡、失眠、抑郁、虚弱、呕吐、厌食。

【用法与用量】口服：起始剂量为一次 250 mg，一日 3 次，一日增加 50 ~ 100 mg，一日极量为 800 mg。服药间隔不短于 6 小时。

【制剂与规格】复方卡比多巴片：① 110 mg（内含卡比多巴 10 mg、左旋多巴 100 mg）；② 125 mg（内含卡比多巴 25 mg、左旋多巴 100 mg）；③ 275 mg（内含卡比多巴 25 mg、左旋多巴 250mg）；④ 250 mg（内含卡比多巴 50 mg、左旋多巴 200 mg）。

卡左双多巴控释片：① 125 mg（内含卡比多巴 25 mg、左旋多巴 100 mg）；② 250 mg（内含卡比多巴 50 mg、左旋多巴 200 mg）。

1.3.1.2 多巴胺受体激动药

左旋多巴在体内转化为多巴胺而起作用，多巴胺受体激动药又分为麦角类和非麦角类。麦角类多巴胺受体激动药包括溴隐亭、α－二氢麦角隐亭；非麦角类多巴胺受体激动药包括吡贝地尔。首次确诊患者，特别是年龄＜65 岁且认知功能正常者多首选多巴胺受体激动药治疗。它们也常常与左旋多巴合用于进展期患者。

与左旋多巴比较，在长期治疗中首先使用多巴胺受体激动药可减少发生运动并发症的机会，但其缺点是尽管治疗最初的半年内对疗效与左旋多巴相当，但此后对运动症状改善的程度不如左旋多巴。而且，更易发生神经精神方面的不良反应。

麦角类多巴胺受体激动药均与纤维化反应（即指与肺、腹膜后、心包纤维化反应）有关，在使用麦角类衍生物前应检测患者的红细胞沉降率、血肌酐和胸部 X 线。用药过程中监测患者有无呼吸困难、持续咳嗽、胸痛、心力衰竭、腹痛或压痛。如预期长期服用，可监测肺功能。大多数情况下，应首选非麦角类多巴胺受体激动药，而不是麦角类。

多巴胺受体激动药会导致白天睡眠过多和发作性睡眠，特别是非麦角类。应告知患者服药期间不应驾车等以避免危险。

多巴胺受体激动药应根据患者的反应和耐受性缓慢加量。

溴隐亭为麦角类多巴胺受体激动药，作为帕金森病的起始治疗，应从小剂量开始，逐渐加量达有效剂量。第 1 周一次 1.25 mg，一日 2 次；第 2 周一次 1.25 mg，一日 3 次；第 3 周一次 2.5mg，一日 3 次；以后根据对药物的反应每 3 ~ 14 天增加 2.5 mg。一日剂量应以达到满意疗效时的剂量作为维持剂量。建议一日剂量最好不要超过 30 mg。与左旋多巴合用治疗帕金森病时有协同作用，应适当减量。餐后服用可减少胃肠道反应。

吡贝地尔[保(乙)]

Piribedil

【适应证】用于老年患者的慢性病理性认知和感觉神经障碍的辅助性症状性治疗，下肢慢性阻塞性动脉病所致的间歇性跛行的辅助性治疗及帕金森病。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 慎用于驾车、机器操作、果糖不耐受者、葡萄糖或半乳糖吸收不良者、蔗糖酶－异麦芽糖不足的患者。

【禁忌证】对本品过敏者、心血管性休克、心肌梗死急性期。

【不良反应】常见胃肠道不适、昏睡、意识紊乱、焦虑、妄想、幻觉、直立性低血压、血压不稳或过敏反应。

【用法与用量】口服：用于帕金森病单药治疗，一日 150 ~ 250 mg，分 3 ~ 5 次服，餐后服用。作为多巴治疗的补充，一日 50 ~ 150 mg。

【制剂与规格】吡贝地尔缓释片：50 mg。

普拉克索[保(乙)]

Pramipexole

【适应证】用于治疗特发性帕金森病的体征和症状 单独或与左旋多巴联用。如在疾病后期左旋多巴的疗效逐渐减弱或出现变化和波动时（剂末现象或“开关”波动），需要应用本品。

【注意事项】(1) 当肾功能损害患者服用本品时，可参照用法与用量项中提示以减少剂量。(2) 幻觉为多巴胺能受体激动药和左旋多巴治疗的不良反应，应告知患者可能会发生幻觉（多为视觉上的）。(3) 对晚期帕金森病者，应联合应用左旋多巴，可能会在本品的初始加量阶段发生运动障碍。如发生上述不良反应，应减少左旋多巴用量。(4) 本品与嗜睡和突然睡眠发作有关，尤其对于帕金森病患者。在日常活动中的突然睡眠发作，有时没有意

识或预兆，但是这种情况很少被报道。必须告知患者这种不良反应，建议其在应用本品治疗过程中要谨慎驾驶车辆或操作机器。已经发生过嗜睡和（或）突然睡眠发作反应的患者，必须避免驾驶或操作机器，且应考虑减量或终止治疗。(5) 由于可能的累加效应，当患者在服用普拉克索时应慎用其他中枢镇静药或乙醇。对有精神障碍的患者，如潜在益处大于风险，应仅用多巴胺能受体激动药进行治疗。普拉克索应避免与抗精神病药物同时应用。(6) 应定期或在发生视觉异常时进行眼科检查。(7) 应注意伴随严重心血管疾病的患者。由于多巴胺能治疗与直立性低血压发生有关，建议监测血压，尤其在治疗初期。(8) 已报道突然终止多巴胺能治疗时会发生非神经阻断性恶性综合征的症状。(9) 普拉克索对妊娠及哺乳期的影响尚未被研究。对大鼠和家兔实验中无致畸作用，但其在母体毒性剂量下对大鼠胚胎有毒性。本品禁用于妊娠期，除非确实需要，如对胎儿潜在的益处大于风险时。由于本品抑制人催乳素的分泌，因此其抑制泌乳。本品是否可分泌到妇女乳汁中还未做研究。大鼠乳汁中药物相关的放射性强度高于血浆。由于缺乏人体数据，应尽可能不在哺乳期内应用本品。

【不良反应】常见失眠、幻觉、精神紊乱、眩晕、运动障碍、嗜睡、突然睡眠发作、恶心、便秘、外周水肿；少见低血压、性欲异常。

【禁忌证】对本品或产品中任何其他成分过敏者禁用。

【用法与用量】口服：用水吞服，伴随或不伴随进食均可，一日 3 次。(1) 初始治疗：初始剂量为一日 0.375 mg，然后每 5 ~ 7 日增加 1 次剂量。如患者可以耐受，应增加剂量以达到最大疗效。如需要进一步增加剂量，应以周为单位，每周加量 1 次，每次日剂量增加 0.75 mg，每日最大剂量为 4.5 mg。然而应注意的是，日剂量高于 1.5 mg 时，嗜睡发生率增加。(2) 维持治疗：个体剂量应在每日 0.375 ~ 4.5 mg。在剂量逐渐增加的三项重要研究中，从每日剂量为 1.5 mg 开始可以观察到药物疗效。做进一步剂量调整应根据临床反应和耐受性进行。在本品加量和维持治疗阶段，建议根据患者的个体反应减少左旋多巴用量。(3) 治疗中止：突然中止多巴胺能治疗会导致非神经阻断性恶性综合征发生。因此，应该以每日减少 0.75 mg 的速度逐渐停止应用普拉克索，直到日剂量降至 0.75 mg。此后，应每日减少 0.375 mg。(4) 肾功能损害患者用药：普拉克索的清除依靠肾功能。对于初始治疗建议应用如下剂量方案： 肌酐清除率高于每分钟 50 ml 的患者无需降低日剂量。肌酐清除率介于每分钟 20 ~ 50 ml 的患者，本品的初始日剂量应分 2 次服用，一次 0.125 mg，一日 2 次。肌酐清除率低于每分钟 20 ml 患者，本品的日剂量应一次服用，从一日 0.125 mg 开始。如在维持治疗阶段肾功能降低，则以与肌酐清除率下降相同的百分比降低本品的日剂量，如当肌酐清除率下降 30%，则本品的日剂量也减少 30%。如果肌酐清除率介于每分钟 20 ~ 50 ml，日剂量应分 2 次服用；如肌酐清除率低于每分钟 20 ml，日剂量应 1 次服用。(5) 肝功能损害患者的用药：对肝衰竭患者可能不需要进行剂量调整，因为所吸收的药物中大约 90% 是通过肾脏排泄的。然而，肝功能不全对本品药动学的潜在影响还未被阐明。

【制剂与规格】普拉克索片：①0.25 mg；② 1 mg。

1.3.1.3 单胺氧化酶 -B 抑制药

常用的单胺氧化酶 -B 抑制药为司来吉兰，与左旋多巴联合应用于进展期帕金森患者以减少“剂末现象”的发生。早期单用司来吉兰可能推迟左旋多巴的使用。当与左旋多巴联合应用时，司来吉兰应避免或尤其慎用于直立性低血压者。

司来吉兰 [保（乙）]

Selegiline

【适应证】单药治疗或与多巴脱羧酶抑制药作为左旋多巴的辅助用药治疗原发性帕金森病或帕金森综合征。

【注意事项】(1) 胃和十二指肠溃疡者、未控制的高血压者、心律失常、心绞痛、精神病、妊娠及哺乳期妇女、儿童慎

用。(2) 治疗帕金森病的用量一日不应超过10 mg。(3) 应避免突然停药。

【禁忌证】对本品过敏者、严重精神病及痴呆、迟发性运动障碍、有消化性溃疡病史者、肾上腺髓质肿瘤、甲状腺功能亢进者、闭角型青光眼。

【不良反应】常见恶心、便秘、腹泻、口干、直立性低血压、运动障碍、眩晕、睡眠障碍、意识模糊、幻觉、关节痛、肌痛、口腔溃疡；罕见心律失常、激动、头痛、排尿困难、皮肤反应、胸痛。

【用法与用量】口服：每早服用10 mg，或早餐、午餐时各服用5 mg，老年人起始剂量可从2.5 mg开始。

【制剂与规格】盐酸司来吉兰片：5 mg。

1.3.1.4 儿茶酚-氧位-甲基转移酶抑制药

此类药物的作用是通过抑制儿茶酚-氧位-甲基转移酶来阻止左旋多巴在外周的代谢，从而使左旋多巴更多地进入脑内。恩他卡朋作为左旋多巴-苄丝肼和左旋多巴-卡比多巴的辅助用药，用于存在“剂末现象”的帕金森病患者。

恩他卡朋[保(乙)]

Entacapone

【适应证】本品可作为标准药物多巴丝肼或左旋多巴-卡比多巴的辅助用药，用于治疗上述药物所不能控制的帕金森病及剂末现象（症状波动）。

【注意事项】(1) 本品可经乳汁分泌，哺乳期妇女慎用或停止哺乳。(2) 不推荐儿童应用。(3) 老年患者体内药物浓度更高，吸收更快，应适当调整剂量。(4) 有酒精中毒和肝功能不全病史者、胆管阻塞者慎用。(5) 在停用本品时应小心，撤药应缓慢，如缓慢撤药仍出现症状或体征者，则需增加左旋多巴的剂量。(6) 在本品和多巴胺激动药如溴隐亭、司来吉兰或金刚烷胺合用时，当开始使用本品时，可能需要调整其他抗帕金森病药的剂量。(7) 本品可能会加重左旋多巴所致的直立性低血压。因此，在驾驶和操纵机器时应谨慎。当患者正在服用其他可致直立性低血压的药物时，使用本品更应谨慎。

【禁忌证】对本品或任何其他组成成分过敏者、肝功能不全者、嗜铬细胞瘤患者、既往有恶性神经阻滞药综合征或非创伤性横纹肌溶解症病史者禁用。

【不良反应】可见直立性低血压、运动障碍、运动功能亢进、头晕、头痛、疲乏、幻觉、震颤、意识模糊、噩梦、失眠、帕金森病症状加重、肌张力障碍、尿色异常、恶心、腹泻、腹痛、口干、便秘、多汗、血红蛋白水平下降等。

【用法与用量】口服：应与左旋多巴/苄丝肼或左旋多巴-卡比多巴同时服用，可和食物同时或不同时服用。每次服用左旋多巴与多巴脱羧酶抑制药的复合制剂时给予本品200 mg（1片），最大推荐剂量是一次200 mg，一日10次，即一日2 g。

【制剂与规格】恩他卡朋片：200 mg。

1.3.1.5 金刚烷胺和抗胆碱药

金刚烷胺是一种微弱的多巴胺受体激动药，有轻微的抗帕金森作用。可以轻微改善运动缓慢，震颤和强直。对晚期患者的运动障碍可能也有效果。可能偶尔出现意识模糊和幻觉。不管患者对药物反应如何，均应缓慢撤药。

抗胆碱药是通过降低脑内胆碱递质过多从而使之与多巴胺处于相对平衡而发挥抗震颤麻痹作用。抗胆碱药可用于药物诱发的帕金森综合征，但是不常规用于帕金森病，因其疗效稍逊于拟多巴胺类药物，且会导致认知受损。

抗胆碱药可减轻抗精神病药所引起的帕金森病症状，但无证据表明要常规给未出现帕金森病症状的服用抗精神病药物的患者应用。

对于帕金森病，抗胆碱药可减轻震颤，对强直和运动迟缓的作用轻微，对减轻流涎可能有效。

金刚烷胺 用于帕金森病（非药物引起的锥体外系症状）和疱疹后神经痛。口服：①治疗帕金森病，一日100 mg，一日1～2次，一日极量400 mg。②治疗疱疹后神经痛，一日2次，一次100 mg，持续14日，如需要再用14日。(其他见9.6.3)

苯海索[基(基)、保(甲)]

Trihexyphenidyl

【适应证】帕金森病、帕金森综合征、药物引起的锥体外系症状。

【注意事项】心血管病、高血压、精神病、发热、闭角型青光眼、肝肾功能不全、妊娠及哺乳期妇女、儿童及伴有动脉硬化的老年患者慎用。

【禁忌证】青光眼、尿潴留、前列腺增生患者。

【不良反应】可见便秘、口干、恶心、呕吐、心动过速、头晕、意识模糊、欣快感、幻觉、记忆力缺损、焦虑、多动、尿潴留、视物模糊、皮疹。

【用法与用量】口服：起始一日 1 mg，以后每 3 ~ 5 日增加 2 mg 至达到最佳疗效且可耐受，分 3 ~ 4 次服用，一日极量为 10 mg。老年人应酌减减量。治疗药物诱发的锥体外系疾病，第 1 日 2 ~ 4 mg，分 2 ~ 3 次服，视情况加至 5 ~ 10 mg。

【制剂与规格】盐酸苯海索片：2 mg。

1.3.2 特发性震颤、舞蹈病的药物治疗

特发性震颤（essential tremor，ET）是一种原因未明的具有遗传倾向的运动障碍性疾病。普萘洛尔或其他 β 肾上腺素受体拮抗药可用于治疗特发性震颤或焦虑引起的震颤。普萘洛尔一日 30 ~ 90 mg，需长期应用。因可减缓心率及降血压，应谨慎从 5 mg，一日 2 次起始，逐渐增加至合适剂量。扑米酮可缓解部分良性特发性震颤，剂量需缓慢增加以减少不良反应。

小舞蹈病（chorea minor，CM）是风湿热在神经系统的常见表现，以舞蹈样不自主动作、肌张力降低、肌力减弱等为临床特征。亨廷顿舞蹈病（Huntington disease，HD）多发于中年人，主要症状为舞蹈样动作与进行性认知障碍。氟哌啶醇对改善相关舞蹈病的症状和运动性抽搐可能有作用。苯海索大剂量使用也可以改善运动障碍；必要时可连续加量数周，直到一日 20 ~ 30 mg 或更大量。吡拉西坦可以作为皮质起源的肌阵挛的辅助用药。

扑米酮[保(乙)]

Primidone

【适应证】用于癫痫阵挛性发作、单纯部分性发作和复杂部分性发作的单方或联合用药治疗，也用于特发性震颤和老年性震颤的治疗。

【注意事项】(1) 对巴比妥类药过敏者对本品也可能过敏。(2) 个体间血药浓度差异很大，因此治疗需要个体化。(3) 治疗期间应按时服药，漏服应尽快补服，但距下次服药前 1 小时不必补服，不可一次服双倍量。(4) 停药时应逐渐减量。(5) 肝肾功能不全、哮喘、肺气肿或其他可能加重呼吸困难或气道不畅等呼吸系统疾病患者、轻微脑功能障碍者慎用。(6) 妊娠及哺乳期妇女使用应权衡利弊。(7) 用药期间应监测血细胞计数，监测扑米酮及其化合物苯巴比妥的血浆浓度。

【禁忌证】对本品及苯巴比妥过敏者。

【不良反应】可见视力改变、复视、眼球震颤、共济失调、情感障碍、精神恍惚。呼吸短促或障碍；少见儿童和老人异常兴奋或不安等反应。偶见过敏反应、粒细胞减少、再生障碍性贫血、红细胞发育不良、巨细胞性贫血；有些不良反应，如眩晕、嗜睡、头痛、食欲减退、恶心、呕吐，继续服药后会减缓或消失。

【用法与用量】①口服：成人常用量，初始剂量一次 50 mg，睡前服用，3 日后改为一日 2 次，1 周后改为一日 3 次，第 10 日改为一次 250 mg，一日 3 次，一日总量不超过 1.5 g；维持量一般为 250mg，一日 3 次。②儿童常用量，8 岁以下儿童，初始剂量一次 50 mg，睡前服用，3 日后改为一次 50 mg，一日 2 次，1 周后一次 100 mg，一日 2 次，10 日后可增至一次 125 ~ 250 mg，一日 3 次，或按体重一日 10 ~ 25 mg/kg，分次服。8 岁以上同成人。

【制剂与规格】扑米酮片：① 50 mg；② 100 mg；③ 250 mg。

1.3.3 变形性肌张力不全的药物治疗

变形性肌张力不全（dystonia musculorum deformans）是一种扭转痉挛，为

锥体外系疾病。

抗胆碱如苯海索（见1.3.1）、左旋多巴或多种镇静类药物可以改善症状。局部注射A型肉毒毒素对于局限型肌张力障碍效果较好。

A型肉毒毒素

Botulinum Toxin Type A

【适应证】用于眼睑痉挛，面肌痉挛等成人患者及某些斜视，特别是急性麻痹性斜视、共同性斜视、内分泌肌病引起的斜视及无法手术矫正或手术效果不佳的12岁以上的斜视患者。

【注意事项】(1) SFDA于2008年7月21日将本品列入医用毒性药品管理，对本品的购买、保存、使用等应严格执行国家规定。(2)发热、急性传染病患者慎用。(3) 以下情况慎用，如心脏、肝脏、血液、肺部疾病患者；肌萎缩性脊髓侧索硬化症或导致周围神经肌肉功能障碍的疾病患者。(4) 12岁以下儿童慎用本品；孕妇使用要权衡利弊；不推荐哺乳期妇女使用。(5) 应准备1：1 000肾上腺素，可用于偶发过敏反应时的急救。患者在注射后应留院内短期观察。(6) 本品用氯化钠注射液溶解后应立即使用，也可置2～8℃冰箱于4小时内用完。残液、容器、注射用具等应消毒处理。

【禁忌证】过敏性体质者及对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 在眼睑、面肌痉挛治疗中，少数患者可出现短暂的眼睑下垂、下睑后退、瞬目减少、睑裂闭合不全、面肌肌力减弱等，3～8周自然恢复。(2) 在斜视治疗过程中，部分患者可出现短暂的、不同程度的眼睑下垂、垂直斜视和极个别的瞳孔散大，此与该毒素向邻近肌肉弥散有关，数周内自然恢复。

【用法与用量】(1) 注射部位：①眼睑痉挛。上、下睑的内外侧或外眦部颞侧皮下眼轮匝肌共4或5点。②单侧面肌痉挛。除注射眼睑痉挛所列部位外，还需于面部中、下及颊部肌内注射3点。依病情需要，也可对眉部内、外或上唇或下颌部肌肉进行注射。③斜视。根据斜视的种类、部位，在0.5%丁卡因注射液表面麻醉下，借肌电放大器或肌电仪引导，用同轴电极针注射不同的眼外肌。(2) 用量：①眼睑及面肌痉挛。每点起始量为2.5 U/0.1 ml。注射1周后有残存痉挛者可追加注射；病情复发者可用原量或加倍量（5.0 U/0.1 ml）注射。但1次注射总剂量应不高于55U，1个月内使用总剂量不高于200 U。②斜视。对垂直肌和＜20棱片镜度的水平斜视，每条肌肉起始量为1.25～2.5 U；对20～40棱片镜度的水平斜视，每条肌肉起始量为2.5 U；对40～50棱片镜度的水平斜视，每条肌内的起始量为2.5 U。以后根据药物反应，酌情增至5.0 U/次；对1个月或以上的持久性展神经（Ⅵ）麻痹，可向内直肌注射1.25～2.5 U。每条肌肉注射容积应不高于0.1 ml。对低矫者可做重复注射。对病情出现反复者可做不定期的增量或维持量注射，但每条肌肉最大用量不超过5 U。

【制剂与规格】注射用A型肉毒毒素：① 50 U；② 100 U。

1.4 中枢神经系统感染性疾病及其用药

中枢神经系统感染性疾病是指由细菌、病毒、寄生虫等各种感染原所引起中枢神经系统炎性疾病。根据中枢神经系统受累的部位分为两类：①脑炎、脊髓炎或脑脊髓炎；②脑膜炎或脑脊膜炎；如脑膜和脑实质均受到明显侵犯时称为脑膜脑炎。

1.4.1 病毒性脑膜炎

病毒性脑膜炎（即化脓性脑膜炎）的药物治疗见9.2.1。

1.4.2 病毒性脑炎

由病毒感染引起的脑实质炎性病变。根据病原学中病毒核酸的特点分为：DNA病毒感染和RNA病毒感染。临床常见单纯疱疹病毒、肠道病毒、水痘－带状疱疹病毒等所致的中枢神经系统感染。

病毒性脑炎的治疗原则是抗病毒、抑制炎症、降颅压以及支持对症治疗。单纯疱疹病毒性脑炎抗病毒的首选药物是阿昔

洛韦，静脉滴注：一次 10 ~ 15 mg/kg，一日 2 ~ 3 次，连续 14 ~ 21 日。也可选用更昔洛韦静脉滴注：一日 5 ~ 10 mg/kg，连续 10 ~ 14 日。为减轻炎性反应和水肿，可短期使用肾上腺皮质激素：地塞米松静脉滴注：一日 10 ~ 20 mg；或甲泼尼龙静脉滴注：一日 800 ~ 1 000 mg；连续 3 日，改为 30 ~ 50 mg，口服。支持对症治疗包括脱水降颅压、降温、抗癫痫、镇静、防止继发感染以及维持水、电解质平衡等。

1.4.3 脑囊虫病的药物治疗

脑囊虫病是链状绦虫（猪绦虫）的幼虫寄生于人脑所引起的疾病。食入外源的绦虫卵或自身寄生绦虫的卵逆行至胃内，胃液消化孵育出幼虫，经血液循环至全身并发育成囊尾蚴。60% ~ 96% 的囊虫寄生于中枢神经系统。脑囊虫病的临床表现与囊虫寄生的部位、数量、时间以及炎症反应的程度有关。主要的症状和体征：头痛、癫痫发作、颅内压增高、精神症状和认知功能障碍、发热、脑膜刺激征、局灶性症状和体征，脑室型可出现 Brun 征。

抗囊虫药物治疗包括：①阿苯达唑，口服，一日 20 mg/kg，分 2 次给予，治疗 10 日，间隔 10 ~ 15 日开始第 2 个疗程，共治疗 3 ~ 5 个疗程。②吡喹酮，口服，一日 10 mg/kg，分 3 次服，治疗 4 日；囊虫数量多、病情重者，采用小剂量、长疗程法，即总剂量 180 mg/kg，9 日分服，一日 3 次。未愈者可间隔 2 ~ 3 个月再治疗 1 个疗程。抗囊虫治疗后，囊尾蚴的异种蛋白可引起明显的炎症反应和脑水肿，使临床症状加重，因此治疗期间必须严密监测，同时给予脱水药和糖皮质激素治疗，有癫痫发作者可使用抗癫痫药控制症状。

1.5 急性脊髓炎及其药物治疗

急性脊髓炎（acute myelitis）指各种感染后因变态反应引起的急性横贯性脊髓炎性病变。这可能是病毒感染或疫苗接种后诱发了机体的自身免疫反应而发病。最常见的病变部位是侵犯胸髓，尤其是胸髓，尤其是胸 3 ~ 5 节段，其次是颈髓、腰髓。临床表现常先有病变节段的束带感或疼痛，继之在数小时至数日内发展为完全性横贯性损害，出现运动、感觉和自主神经功能障碍。部分病例起病急骤，脊髓受累节段迅速上升至高颈髓，出现四肢瘫痪、吞咽困难、构音不清、呼吸肌麻痹而死亡，称上升性脊髓炎。

急性脊髓炎的药物治疗包括：①糖皮质激素。甲泼尼松龙静脉滴注，一日 500 ~ 1 000 mg，连续 3 ~ 5 日；或地塞米松静脉滴注，一日 10 ~ 20 mg，连续 10 日。然后改用口服泼尼松或泼尼松龙，一日 60 mg，逐渐减量停用。②人免疫球蛋白。静脉滴注，0.4 g/kg，成人一日 15 ~ 20 g，连续 3 ~ 5 日。③根据病情选用抗菌药物和抗病毒药治疗。④ B 族维生素。肌内注射，维生素 B_1 一次 100 mg、维生素 B_{12} 500 μg，一日 1 次。⑤可适当选用神经营养药物（如腺苷三磷酸、胞磷胆碱等）和血管扩张药。

1.6 多发性硬化病及其药物治疗

多发性硬化病（multiple sclerosis，MS）是一种以中枢神经系统白质脱髓鞘病变为主要病理特点的自身免疫性疾病。多数患者亚急性起病，具有时间和空间的多发性。多发性硬化病临床可分为 4 型：复发 - 缓解型、原发进展型、继发进展型和进展复发型。视神经脊髓炎可能是多发性硬化病的亚型或变异型。

多发性硬化病目前尚无根治疗法。治疗的目的主要是抑制炎性脱髓鞘病变的进展，尽可能减少缓解期的复发，晚期采取对症和支持治疗。药物治疗包括如下几类。

（1）糖皮质激素：是多发性硬化病急性期和复发的主要治疗药物，具有抗炎和免疫调节作用，缩短急性期和复发期的病程，但不能防止复发。常用的药物有：①甲泼尼龙。目前主张在多发性硬化的急性活动期使用。主张大剂量短程疗法，静脉滴注，1 000 mg 加入 5% 葡萄糖注射液 500 ml，于 3 ~ 4 小时滴毕，一日 1 次，连续 3 ~ 5 日；然后改口服泼尼松或甲泼尼龙一次 60 mg，一日 1 次，至停药。②泼尼松。口服一次 80 mg，一日 1 次，

连续7日；依次减量为60 mg，一日1次，连续5日；40 mg，一日1次，连续5日；以后每5日减10 mg，连续4～6周为1个疗程。

（2）β-干扰素（Interferon-β, IFN-β）：IFN-β_{1a} 皮下注射，一次44 μg一周3次；或IFN-β_{1b} 皮下注射，一次50 μg，隔日1次。

（3）免疫抑制药：能减轻多发性硬化的症状，但对脱髓鞘病灶无减少的趋势，且不良反应大，目前已较少使用。①硫唑嘌呤。口服，2 mg/kg，一日1次，治疗2年，可缓解病情的进展，降低多发性硬化的复发率。②甲氨蝶呤。口服，一周7.5 mg，治疗2年，对继发进展型多发性硬化复发的预防有一定的作用。③环磷酰胺。口服，一次50 mg，一日2次，治疗1年。④环孢素。口服，一次5～10 mg/kg，一日1次。

（4）免疫球蛋白：可能是通过封闭体内髓鞘碱性蛋白特异性抗体发挥作用的，主张大剂量冲击治疗。静脉滴注，0.4 mg/kg，一日1次，连续3～5日为1个疗程。可根据病情需要每个月加强1次，连续治疗3～6个月。

（5）血浆置换疗法：治疗作用可能与清除自身抗体有关。可用于急性进展型和暴发型多发性硬化患者。一次置换30～50 ml/kg，一周1～2次，10～20次为1个疗程。

（6）对症治疗：①痛性痉挛。巴氯芬见（1.9.2）、卡马西平（见1.8）、地西泮和氯硝西泮（见1.12）等。②膀胱功能障碍。拟胆碱类药物如氯化卡巴胆碱或氯化乌拉碱。③疲乏。金刚烷胺（见9.6.3）、莫达非尼（modafinil）。④震颤。苯海索、左旋多巴等。

1.7 神经肌肉病及其用药

1.7.1 低钾型周期性瘫痪及其药物治疗

低钾型周期性瘫痪为周期性瘫痪中最常见的类型，以发作性肌无力、伴血清钾降低、补钾后能迅速缓解为特征。

发作轻时不需治疗。

全身性肌力减弱时口服补充钾盐，常用氯化钾一日2～10 g，先用10%氯化钾溶液40～50 ml顿服，24小时内再分次口服10%氯化钾溶液30～60 ml，维持直到完全恢复。

严重病例或不适口服者，用10%氯化钾注射液30～40 ml溶于氯化钠注射液1 000～1 500 ml中静脉滴注，并观察肌力及心电图变化，每小时氯化钾的输入量不得超过1 g。由于等渗盐溶液仍可降低血钾水平，因此，推荐应用5%甘露醇注射液稀释。输钾要控制速度及输入总量，应每日监测血钾浓度。

1.7.2 重症肌无力的药物治疗

重症肌无力（myasthenia gravis, MG）是一种神经肌肉接头传递障碍的获得性自身免疫性疾病。病变主要累及神经-肌肉接头突触后膜上的乙酰胆碱受体。临床特征为部分或全身骨骼肌极易疲劳，通常在活动后症状加重，经休息和胆碱酯酶抑制药治疗后症状减轻。主要治疗方案如下。

如为手术适应证可考虑胸腺摘除，若术后病情明显恶化，则考虑辅以血浆置换、糖皮质激素，甚至胆碱酶抑制药治疗。

非手术治疗应先用血浆置换、糖皮质激素，渐过渡到单用糖皮质激素。待病情好转且稳定2个月后行胸腺摘除，术后维持原剂量2个月，再酌情渐减量，于2～4年缓慢减量乃至停用糖皮质激素，还包括免疫球蛋白和新斯的明等药物治疗。

在糖皮质激素减量过程中，可适量加用硫唑嘌呤、环孢素等其他免疫抑制药，以减少和减轻“反跳现象”。不能耐受糖皮质激素治疗，可考虑使用环磷酰胺。

糖皮质激素，可抑制自身免疫反应，适用于各种类型重症肌无力。它通过抑制乙酰胆碱受体抗体的生成，增加突触前膜乙酰胆碱的释放量及促使运动终板再生和修复。

冲击疗法：甲泼尼龙1 000 mg静脉滴注，一日1次，连续3～5日，随后地塞米松10～20 mg静脉滴注，一日1次，连续7～10日。若吞咽功能改善或病情稳定，停用地塞米松，改为泼尼松80～100 mg每晨顿服。当症状基本消失后，

每周减2次，一次减10 mg，减至一日60 mg，然后每周减1次，一次减5 mg；减至一日40 mg时，开始减隔日量，每周减5 mg，即周一、三、五服40 mg，周二、四、六服35 mg；下一周的隔日量为30 mg，以此类推，直至隔日量减为0。以后隔日晨顿服泼尼松40 mg，维持1年以上。若病情无反复，每月减5 mg，直至完全停药或隔日5 ~ 15 mg长期维持。若中途病情波动，则需随时调整剂量。经过该疗法治疗，大多数患者有好转，对高龄、胸腺瘤患者疗效较好，疗效与病程无关。应当用足量60日才能宣告无效。同时配合血浆置换，可避免肌无力加重。早期加重与其后的疗效无关。一开始就口服泼尼松一日60 ~ 80 mg，大约2周后症状逐渐缓解，常于数月后疗效达高峰，然后逐渐减量。

人免疫球蛋白 大剂量静脉注射免疫球蛋白。外源性IgG可使乙酰胆碱受体抗体的结合功能紊乱而干扰免疫反应。一般应用大剂量免疫球蛋白一日0.4 g/kg，连续5日为1个疗程。(其他见18.3.1.2)

硫唑嘌呤 免疫抑制药适用于有高血压、糖尿病、溃疡病而不能用糖皮质激素，或不能耐受糖皮质激素，而对糖皮质激素疗效不佳者。(其他见7.1.2.3)

新斯的明 是人工合成、化学结构与毒扁豆碱相似的化合物，对肢体无力效果较好。甲硫酸新斯的明溶液稳定性好，供注射用，一般用0.5 mg。口服常用溴新斯的明15 mg，口服后大部分于肠内破坏，故口服有效剂量为注射剂量者的30倍。口服约15分钟起效，30 ~ 60分钟作用达高峰，持续2 ~ 6小时，其后迅速消失。故日剂量及用药间隔时间需因人而异。从一次45 mg，一日3次（一日135 mg），到每2小时1次（一日剂量一般不超过180 mg）。一般在进餐或做特殊体力劳动前15 ~ 30分钟可口服15 mg。(其他见17.2.3)

吡斯的明 为胆碱酯酶抑制药。起效温和、平稳、作用时间较长（2 ~ 8小时）和逐渐减效等特点，故一般给药间隔时间为6 ~ 8小时。对延髓支配的肌肉无力效果较好。病情严重者可酌情加量。病情一旦控制，作用可维持过夜。对某些病例可与溴新斯的明合用，一般白天和晚上用溴吡斯的明而早晨用溴新斯的明。

莫达非尼

Modafinil

【适应证】用于发作性睡病、嗜睡症等。

【注意事项】(1) 儿童、老年人、孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 高血压、不稳定性心绞痛、心肌梗死、肝硬化、肝肾功能不全和精神病患者慎用。(3) 慎与抗惊厥药合用。(4) 用药期间限制饮酒，不要自行停用本药。

【禁忌证】心、肝、肾功能不全者禁用。

【不良反应】失眠、食欲缺乏。

【用法与用量】口服，一次50 ~ 100 mg，一日1次，睡前1 ~ 5小时服，每4 ~ 5天增加50 mg，最大剂量一日200 ~ 400 mg。

【制剂与规格】莫达非尼片：100 mg。

溴吡斯的明[保(甲)]

Pyridostigmine Bromide

【适应证】用于重症肌无力、手术后功能性肠胀气及尿潴留等。

【注意事项】(1) 儿童、老年人、孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 心律失常、房室传导阻滞、术后肺不张或肺炎者慎用。(3) 本品在吸收、分布、代谢、排泄上存在明显的个体差异，其药量和用药时间应根据服药后效应而定。

【禁忌证】对本品过敏、心绞痛、支气管哮喘、机械性肠梗阻及尿路梗阻。

【不良反应】常见腹泻、恶心、呕吐、胃痉挛、出汗及唾液增多等，少见尿频、瞳孔缩小，大剂量常可出现精神异常。

【用法与用量】口服：一般成人一次60 ~ 120 mg，每3 ~ 4小时1次。

【制剂与规格】溴吡斯的明片：60 mg。

1.7.3 多发性肌炎的药物治疗

多发性肌炎是一组多种病因引起的弥漫性骨骼肌炎症性疾病，临床上以急性

或亚急性起病、对称性四肢近端和颈肌及咽肌无力、肌肉压痛、血清肌酶增高和骨骼肌坏死及淋巴细胞浸润为特征，同时伴有红细胞沉降率增快及肌电图呈肌源性损害，应用糖皮质激素治疗效果较好。

糖皮质激素　常用泼尼松，按体重一日 1 mg/kg，分 3 次口服，也可一日晨顿服或隔日双倍剂量服用。病情好转稳定后可逐渐减量，每 2 ~ 3 周减 5 mg，直至剂量减至一日 20 mg，或改为隔日 40 mg。疗程 6 ~ 12 个月或更长，服用维持量一日 7.5 ~ 20 mg，直至完全停药，应维持治疗 1 ~ 2 年，过早停用可引起复发，复发后治疗更加困难。急性或危重病例可用大剂量甲泼尼龙冲击疗法，以甲泼尼龙 500 ~ 1 000 mg，2 小时内静脉滴注，一日 1 次，连续 3 ~ 5 日，可提高治疗成功率，也可在口服泼尼松起效前临时应用。要取得最佳疗效用药须足量，初始治疗剂量要大，减量不宜过快，可根据肌力改善及血清肌酸激酶变化调整药量，治疗有效时肌酸激酶先降低，然后肌力改善，无效者肌酸激酶继续升高。（其他见 5.4.4）

硫唑嘌呤[基（基）]　激素治疗无效或不能耐受的患者可用硫唑嘌呤，无糖皮质激素不良反应，适用于需长期应用免疫抑制药的患者。（其他见 7.1.2.3）

人免疫球蛋白　大剂量静脉注射人免疫球蛋白急性期应用效果较好。一般应用人免疫球蛋白一日 0.4 g/kg，连续 5 日为 1 个疗程，1 个月 1 次，根据病情可连续数月，4 个月为 1 个疗程。可减少免疫抑制药的用量。（其他见 18.3.1.2）

1.8　癫痫及其药物治疗

1.8.1　抗癫痫药的应用原则

（1）抗癫痫药应长期规则用药，剂量一般从低剂量开始（可以减少不良反应）逐渐增加，直到癫痫发作被控制而又无明显的不良反应，即最佳剂量最佳疗效。

（2）给药的次数要根据该药血浆半衰期来确定。大多数抗癫痫药剂量的使用可以分为一日给药 2 次和给药 3 次（即每 12 小时或每 8 小时 1 次）。血浆半衰期较长的药品如苯巴比妥和苯妥英钠等，可一日睡前给一次量即可。但由于有些抗癫痫药剂量偏大，可能需要一日 3 次给药以避免出现与高峰血药浓度相关的不良反应。抗癫痫药在儿童体内的代谢比成人要快，因此儿童患者使用此类药需要更频繁地调整剂量并要按体重计算给药量。

（3）抗癫痫药主要依据癫痫发作的类型进行选择。

①伴有或不伴泛化的部分性发作：卡马西平、拉莫三嗪、奥卡西平、丙戊酸钠、托吡酯是部分发作的首选药物；二线药包括加巴喷丁、左乙拉西坦、噻加宾、唑尼沙胺、氯巴占。

②泛化全面性发作。

强直阵挛性发作（大发作）：首选卡马西平、拉莫三嗪、丙戊酸钠或托吡酯。二线药是氯巴占、左乙拉西坦或奥卡西平。

失神发作（小发作）：典型失神发作乙琥胺和丙戊酸钠是首选药，替代方案包括氯硝西泮和拉莫三嗪。丙戊酸钠在治疗可能与失神发作共存的特发性初期的全面强直－阵挛性发作癫痫也是非常有效的。

肌阵挛发作：可以在一系列综合征中出现，并对治疗的反应差别很大。丙戊酸钠是首选药物；氯硝西泮与左乙拉西坦也可以使用。替代方案包括拉莫三嗪和托吡酯，但拉莫三嗪可能偶尔会加重肌阵挛发作。可辅助使用吡拉西坦。丙戊酸钠与左乙拉西坦在治疗可能伴肌阵挛的特发性泛化的全面强直阵挛性发作癫痫是有效的。

非典型失神，失张力和强直发作：通常出现于儿童，表现为特定癫痫综合征，或与脑外伤或智力迟钝相关。它们可能仅对传统药物有反应。丙戊酸钠、拉莫三嗪，氯硝西泮可以尝试。偶尔会有帮助的第二线药包括氯巴占、左乙拉西坦、托吡酯。

（4）联合治疗：在单药治疗无效时才能考虑同时使用两种或两种以上的抗癫痫药的联合治疗。此时可增加药物毒性以及可能发生抗癫痫药之间的药物相互作用。这种药物相互作用是复杂的，有高度可变性和不可预测性，可能毒性增高而药效并没有相应增加。药物相互作用往往通过诱

导或抑制代谢酶以及竞争性蛋白结合而产生。在抗癫痫药之间发生的明显药物相互作用如下。

卡马西平,常可降低氯巴占、氯硝西泮、拉莫三嗪、奥卡西平和苯妥英钠的活性代谢物（但也可能提高苯妥英钠的浓度）、噻加宾、托吡酯、丙戊酸钠、唑尼沙胺的血药浓度。有时降低乙琥胺，扑米酮血药浓度（但有相应增加苯巴比妥水平的趋势）。

乙琥胺，有时会升高苯妥英钠的血药浓度。

苯巴比妥或扑米酮，常可降低卡马西平、氯硝西泮、拉莫三嗪、苯妥英钠（但也可能提高其血浓度）、噻加宾，丙戊酸盐，唑尼沙胺血药浓度。有时降低乙琥胺血药浓度。

苯妥英钠，常可降低氯硝西泮、卡马西平、拉莫三嗪，奥卡西平活性代谢产物及噻加宾，托吡酯、丙戊酸钠、唑尼沙胺的血药浓度。常常升高苯巴比妥血药浓度，有时降低乙琥胺、扑痫酮血药浓度（通过提高苯巴比妥转化率）。

丙戊酸盐，有时降低奥卡西平活性代谢物的血药浓度。常可升高卡马西平活性代谢物、拉莫三嗪、扑痫酮、苯巴比妥、苯妥英钠（但也可能降低）血药浓度，有时会升高乙琥胺，扑米酮血药浓度（和显著增加苯巴比妥水平的趋势）。

托吡酯，有时会升高苯妥英钠血药浓度。

拉莫三嗪，有时会升高卡马西平活性代谢物的血药浓度（但证据相互矛盾）。

左乙拉西坦，没有与左乙拉西坦药物相互作用的报道。

奥卡西平，有时降低卡马西平血药浓度（但可能会升高卡马西平活性代谢产物的血药浓度），有时会升高苯妥英钠的血药浓度，常常升高苯巴比妥的血药浓度。

加巴喷丁，尚没有与加巴喷丁药物相互作用的报道。

氨己烯酸，常可降低苯妥英钠血药浓度，有时降低苯巴比妥、扑米酮血药浓度。

（5）换药与停药：抗癫痫药应在神经内科医师指导下停药。除非必需，应避免突然停药，尤其是巴比妥类及苯二氮䓬类药物。因为这可使发作加重。减少剂量也应循序渐减，如巴比妥类，撤药可能需要几个月的时间甚至更长。从一个抗癫痫药换为另一种也应谨慎，只有当新的服药法已大致确立（新药达稳态血浓度约需经过该药的5个半衰期的时间，一般1～2周），才可渐减第1种药物。接受几种抗癫痫药治疗时，不能同时停，只能先停一种药，无碍时再停另一种。决定给一个已停止癫痫发作的患者停用抗癫痫药，其时机往往是困难的，并需视个体情况而定（为何种发作类型或癫痫综合征、有无脑结构或脑电图异常、有无癫痫持续状态病史等）。也要避免在患者的青春期、月经期、妊娠期等停药。即使患者已无癫痫发作数年之久又无上述之一的情况，停药也有癫痫复发的风险。

（6）驾驶：患有癫痫病史的患者，也只能在他们已有1年无发作，或已确定在3年中只在睡眠时发作而无觉醒发作时，才有可能驾卧车或小型货车（绝不可驾大货车或大轿车等车辆及运营车辆）；有晕厥的患者不应驾驶或操作机械。患者不要在撤用抗癫痫药物期间开车，而应于撤药后6个月再驾车。

（7）孕期和哺乳期：应用抗癫痫药有致畸风险，尤其神经管和其他相关缺陷的风险增加，特别是与卡马西平、拉莫三嗪、奥卡西平、苯妥英钠、丙戊酸钠联合应用。应告知育龄妇女服用抗癫痫药可能产生的后果，拟妊娠或孕期妇女应向专家咨询，并提供产前筛查（甲胎蛋白检测和孕中期超声波检查）。

对接受抗癫痫药治疗的妇女，为降低神经管缺陷的风险，建议在孕前和孕期应补充足够的叶酸，一日5 mg。

抗癫痫药在血浆中的浓度在妊娠期可以改变，尤其是在后期。抗癫痫药的剂量在妊娠期和分娩后应小心监测，并根据临床情况随时调整。

在妊娠后期的3个月，一日给予维生素K 10 mg，可以有效地预防任何抗癫痫药相关的新生儿出血的风险。

乙琥胺[保（乙）]

Ethosuximid

【适应证】用于癫痫失神发作（小发

作)。

【注意事项】(1) 不宜突然停药。(2)有大发作和小发作的混合型癫痫发作的患者，注意联合应用抗大癫痫发作药物。(3) 肝肾功能不全、贫血者、孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 用药期间须监测肝、肾功能和尿常规。

【禁忌证】对本品及其他琥珀酰亚胺类药过敏者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、上腹不适、食欲减退；少见头晕、头痛、眩晕、嗜睡、疲乏、精神状态改变、发热、血小板减少、皮疹等；偶见粒细胞减少、再生障碍性贫血及肝肾功能损害；个别患者出现过敏反应。

【用法与用量】口服：(1) 成人常用量，初始剂量一次 0.25 g，一日 2 次，以后每 4 ~ 7 日增加 0.25 g，直至控制癫痫发作，一日最大剂量不超过 1.5 g。(2) 儿童常用量：① 6 岁以下，初始剂量为一次 0.25 g，一日 1 次，以后每 4 ~ 7 日增加 0.25 g，直至控制癫痫发作，一日最大剂量不超过 1 g，分次服用；② 6 岁以上儿童，用法与用量同成人。

【制剂与规格】乙琥胺胶囊：0.25 g。

乙琥胺糖浆：100 ml ∶ 5 g。

苯妥英钠 [基(基)，保(甲)]

Phenytoin Sodium

【适应证】用于治疗全身强直阵挛性发作（精神运动性发作、颞叶癫痫）、单纯及复杂部分性发作（局限性发作）、继发性全面发作和癫痫持续状态。可用于治疗三叉神经痛，隐性营养不良性大疱性表皮松解，发作性舞蹈手足徐动症，发作性控制障碍（包括发怒、焦虑和失眠的兴奋过度等的行为障碍疾患），肌强直症及三环类抗抑郁药过量时心脏传导障碍等；本品也适用于洋地黄中毒所致的室性及室上性心律失常。

【注意事项】(1) 本品可通过胎盘屏障而致畸，并可由乳汁分泌，哺乳期妇女应停止哺乳。(2) 嗜酒者、贫血、心血管病、糖尿病、肝肾功能损害、甲状腺功能异常者慎用。(3) 儿童应经常检测血药浓度，以决定用药次数和用量。(4) 老年人用药需慎重，用量宜小，并监测血浆浓度。(5) 用药期间须监测血常规、肝功能、血钙、脑电图和甲状腺功能等，静脉使用本品时应进行持续的心电图、血压监测。

【禁忌证】对本品过敏者 阿斯综合征、一至二度房室传导阻滞、窦房结阻滞、窦性心动过缓等心功能损害、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见行为改变、笨拙、步态不稳、思维混乱、持续性眼球震颤、小脑前庭症状、发作次数增多、精神改变、肌力减弱、发音不清、手抖；长期应用可引起的中枢神经系统或小脑中毒所致的非正常兴奋、神经质、烦躁、易激惹、牙龈增生、出血、多毛；少见颈部或腋部淋巴结肿大、发热。

【用法与用量】口服：①成人常用量。一日 250 ~ 300 mg，开始时 100 mg，一日 2 次，1 ~ 3 周增加至一日 250 ~ 300 mg，分 3 次口服，极量一次 300 mg，一日 500 mg。由于个体差异，用药需个体化。应用达到控制发作和血药浓度达稳态后，可改用长效（控释）制剂顿服。如发作频繁，可按体重 12 ~ 15 mg/kg，分 2 ~ 3 次服用，每 6 小时 1 次，第二天开始给予 100 mg（或按体重 1.5 ~ 2 mg/kg），一日 3 次，直到调整至恰当剂量为止。②小儿常用量。开始一日 5 mg/kg，分 2 ~ 3 次服用，按需调整，一日不超过 250 mg，维持量为 4 ~ 8 mg/kg 或按体表面积 250 mg/m^2，分 2 ~ 3 次服用。

【制剂与规格】苯妥英钠片：①50 mg；② 100 mg。

卡马西平 [基(基)，保(甲/乙)]

Carbamazepine

【适应证】用于治疗癫痫(部分性发作、复杂部分性发作、简单部分性发作和继发性全身发作。全身性发作：强直发作、阵挛发作、强直-阵挛发作)、躁狂症、三叉神经痛、神经源性尿崩症、糖尿病神经病变引起的疼痛；预防或治疗躁郁症。

【注意事项】(1) 酒精中毒、冠状动脉硬化等心脏病、肝脏疾病、肾脏疾病或尿潴留者、糖尿病、青光眼、使用其他药物有血液系统不良反应史者（本品诱发骨

髓抑制的危险性增加)、ADH 分泌异常或有其他内分泌紊乱慎用。(2) 老年人对本品较为敏感，可引起认知功能障碍、精神错乱、激动、不安、焦虑、房室传导阻滞或心动过缓，也可引起再生障碍性贫血。(3) 用药前、后及用药时应监测全血细胞计数(血小板、网织红细胞)及血清铁检查。在给药前检查一次，治疗开始后应经常复查达 2 ~ 3 年、尿常规、血尿素氮、肝功能检查、血药浓度监测、眼科检查（包括裂隙灯、检眼镜和眼压检查。有条件者应检查人体白细胞抗原等位基因。

【禁忌证】对本品或三环类抗抑郁药过敏、房室传导阻滞、血常规及血清铁严重异常、骨髓抑制等病史者或急性间歇性卟啉症者、严重肝功能不全者禁用。本品可透过胎盘屏障，妊娠期妇女使用本品，可致胎儿脊柱裂等先天畸形，尤其在妊娠早期，孕妇应禁用。本品可通过乳汁分泌，乳汁中浓度约为血药浓度的 60%，哺乳期妇女应禁用。

【不良反应】常见中枢神经系统反应，表现为头晕、共济失调、嗜睡、视物模糊、复视、眼球震颤。少见变态反应、Stevens-Johnson 综合征、儿童行为障碍、严重腹泻、稀释性低钠血症或水中毒、中毒性表皮坏死溶解症、红斑狼疮样综合征。罕见腺体瘤或淋巴腺瘤、粒细胞减少、骨髓抑制、心律失常、房室传导阻滞等、中枢神经毒性反应、过敏性肝炎、低钙血症等。

【用法与用量】口服：(1) 成人：①癫痫治疗。初始剂量一次 100 ~ 200 mg，一日 1 ~ 2 次，逐渐增加剂量至最佳疗效（通常为一日 400 mg，一日 2 ~ 3 次)。某些患者需增加至一日 1 600 mg，甚至 2 000 mg。②躁狂症的治疗和躁郁症的预防治疗。剂量一日 400 ~ 1 600 mg，通常剂量为一日 400 ~ 600 mg，分 2 ~ 3 次服。③三叉神经痛。初始剂量为一次 100 mg，一日 2 ~ 3 次，逐渐增加剂量至疼痛缓解（通常为一次 200 mg，一日 3 ~ 4 次)。④乙醇戒断综合征。一次 200 mg，一日 3 ~ 4 次。⑤中枢性尿崩症。平均剂量一次 200 mg，一日 2 ~ 3 次。⑥糖尿病神经病变引起的疼痛。平均剂量一次 200 mg，一日 2 ~ 4 次。(2) 儿童：一日 10 ~ 20 mg/kg，1 岁以下一日 100 ~ 200 mg，1 ~ 5 岁一日 200 ~ 400 mg，6 ~ 10 岁一日 400 ~ 600 mg，11 ~ 15 岁一日 600 ~ 1 000 mg，分 3 ~ 4 次服用。维持量调整到血药浓度为 4 ~ 12 μg/ml。

【制剂与规格】卡马西平片：① 100 mg；② 200 mg；③ 400 mg。

卡马西平缓释片：① 200 mg；② 400 mg。

丙戊酸钠 [基(基)，保(甲/乙)]

Sodium Valproate

【适应证】用于各种类型的癫痫包括失神发作、肌阵挛发作、强直阵挛发作、失张力发作及混合型发作、特殊类型癫痫(West，Lennox-Gastaut 综合征)，也用于部分性发作，如局部癫痫发作，尚可用于双相情感障碍相关的躁狂发作。

【注意事项】(1) 孕妇用药应权衡利弊，本品可由乳汁分泌，哺乳期妇女慎用。(2) 3 岁以下儿童使用本品发生肝功能损害的危险较大，且本品可蓄积在发育的骨骼内，需引起注意。(3) 用药前、后及用药时应监测全血细胞计数、出凝血时间、肝肾功能，肝功能在最初半年内宜每 1 ~ 2 个月复查 1 次，半年后复查间隔酌情延长；必要时监测血浆丙戊酸钠浓度。(4) 服用本品患者出现腹痛、恶心、呕吐时应及时检查血清淀粉酶。(5) 用药期间禁止饮酒。(6) 停药时应逐渐减量。

【禁忌证】对本品过敏、急慢性肝炎，严重肝炎病史及家族史，特别是与药物相关的肝卟啉病患者，患有尿素循环障碍疾病的患者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、腹痛、腹泻、消化不良、胃肠痉挛、月经周期改变；少见脱发、眩晕、疲乏、头痛、共济失调、异常兴奋、不安和烦躁；偶见过敏、听力下降、可逆性听力损坏，长期服用偶见胰腺炎及急性重型肝炎。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量。按体重一日 15 mg/kg 或一日 600 ~ 1 200 mg，分 2 ~ 3 次服。开始时按 5 ~ 10 mg/kg，1 周后递增，至发作控制为止。当一日用量超过 250 mg 时应分次服用，以减少胃肠刺激。一日最大剂量为按体

重不超过 30 mg/kg 或一日 1.8 ~ 2.4 g。②儿童常用量。按体重计与成人相同，也可一日 20 ~ 30 mg/kg，分 2 ~ 3 次服或一日 15 mg/kg，按需每隔一周增加 5 ~ 10 mg/kg，至有效或不能耐受为止。(2) 静脉滴注：用于临时替代时（例如等待手术时）末次口服给药 4 ~ 6 小时静脉给药。本品静脉注射溶于 0.9% 氯化钠注射液，或持续静脉滴注超过 24 小时。或在最大剂量范围内（通常平均剂量为一日 20 ~ 30 mg/kg）一日分 4 次静脉滴注，一次时间需超过 1 小时。需要快速达到有效血药浓度并维持时：以 15 mg/kg 剂量缓慢静脉注射，超过 5 分钟，然后以每小时 1 mg/kg 的速度静脉滴注，使血浆丙戊酸浓度达到 75 mg/L，并根据临床情况调整静脉滴注速度。一旦停止静脉滴注，需要立即口服给药，以补充有效成分，口服剂量可以用以前的剂量或调整后的剂量。

【制剂与规格】丙戊酸钠片：① 100 mg；② 200 mg。

丙戊酸钠肠溶片：① 250 mg；② 500 mg。

丙戊酸钠胶囊：① 200 mg；② 250 mg。

丙戊酸钠糖浆：① 5 ml : 200 mg；② 5 ml : 500 mg。

丙戊酸钠口服溶液：300 ml : 12 g。

注射用丙戊酸钠：400 mg。

丙戊酸钠注射液：4 ml : 400 mg。

丙戊酸镁 [保（乙）]

Magnesium Valproate

【适应证】用于治疗各型癫痫，尤其是以下类型：失神发作、肌阵挛发作、强直阵挛发作、失张力发作、混合型发作、部分性癫痫、简单性或复杂性发作、继发性全身性发作、特殊类型的综合征。也可用于治疗双相情感障碍的躁狂发作。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者应减量或慎用，血小板减少症患者慎用。用药期间应定期检查肝功能与白细胞、血小板计数。(2) 出现意识障碍、肝功能异常、胰腺炎等严重不良反应，应停药。(3) 本品发生不良反应与血药浓度过高（>120 μg/ml）有关，故最好进行血药浓度监测。(4) 本品可泌人乳汁，哺乳期妇女使用本品期间应停止哺乳。(5) 老年患者用药视病情酌情减量。

【禁忌证】白细胞减少、严重肝脏疾病者、6 岁以下儿童及孕妇禁用。

【不良反应】常见有恶心、呕吐、畏食、腹泻等。少数可出现嗜睡、震颤、共济失调、脱发、异常兴奋与烦躁不安等。偶见过敏性皮疹、血小板减少或血小板聚集抑制引起异常出血、白细胞减少或中毒性肝损害。

【用法与用量】成人：一次 250 mg，一日 2 次，根据个体差异及血药浓度适当调整。最高剂量不超过一日 1 600 mg。6 岁以上儿童一日 20 ~ 30 mg/kg，分 3 ~ 4 次服用。

【制剂与规格】丙戊酸镁片：250 mg。

托吡酯 [保（乙）]

Topiramate

【适应证】用于成人及 2 岁以上儿童癫痫发作的辅助治疗，初诊为癫痫患者的单药治疗或曾经合并用药现转为单药治疗的癫痫患者。

【注意事项】(1) 本品可通过胎盘屏障而致畸，孕妇慎用。(2) 行为障碍及认知缺陷者、泌尿道结石、感觉异常者、易发生酸中毒者、哺乳期妇女、肝肾功能不全者慎用。(3) 停药时应逐渐减量。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】可有恶心、食欲减退、味觉异常、头晕、头痛、疲乏、嗜睡、感觉异常、共济失调、语言障碍、注意力障碍、意识模糊、情绪不稳、抑郁、焦虑、失眠；可有复视、眼球震颤、视觉异常。也有引起假性近视及继发性闭角型青光眼、肾结石、体重减轻的报道。

【用法与用量】口服：(1) 抗癫痫治疗。①成人常用量由一日 50 mg 开始，每周增加剂量 1 次，每次增加 25 mg，至症状控制为止。维持量为一日 100 ~ 200 mg，分 2 次服。②儿童剂量由一日 0.5 ~ 1 mg/kg 开始，每周增加一日 0.5 ~ 1 mg/kg，维持剂量为一日 3 ~ 6 mg/kg。(2) 用于偏头痛的预防性治疗，宜从小剂量开始，一日 15 ~ 25 mg，睡前服用，以后酌情逐增剂量，可达一日 100 ~ 200 mg，分 3 次服用。

【制剂与规格】托吡酯片：① 25 mg；

②50 mg；③ 100 mg。

托吡酯胶囊：①100 mg；②300 mg；③400 mg。

左乙拉西坦[保(乙)]

Levetiracetam

【适应证】用于成人及4岁以上儿童癫痫患者部分性发作的加用治疗。

【注意事项】(1) 如需停止服用本品，建议逐渐停药。(2) 患者对加用左乙拉西坦治疗有效应，可以停止原合并应用的抗癫痫药物。(3) 对于严重肝功能损害的患者，需调整剂量。(4) 目前没有研究关于服药后对机器驾驭能力和驾驶车辆能力的影响。由于个体敏感性差异，在治疗初始阶段或者剂量增加后，会产生嗜睡或者其他中枢神经症状。因而不推荐驾驶汽车或操纵机器者使用。

【禁忌证】对左乙拉西坦或吡咯烷酮衍生物过敏者。

【不良反应】最常见的不良反应有嗜睡，乏力和头晕，常发生在治疗的开始阶段。随时间的推移，中枢神经系统相关的不良反应发生率和严重程度会随之降低。左乙拉西坦不良反应没有明显的剂量相关性。儿童最常见的不良反应有嗜睡、敌意、神经质、情绪不稳、易激动、食欲减退、乏力和头痛。除行为和精神方面不良反应发生率较成人高（儿童38.6%，成人18.6%）外，总的安全性和成人相仿。

【用法与用量】口服：(1) 成人（>18岁）和青少年（12～17岁）（体重≥50 kg者），起始治疗剂量为一次500 mg，一日2次。根据临床效果及耐受性，一日剂量可增加至一次1 500 mg，一日2次。剂量的变化应每2～4周1次，每日2次，增加或减少500 mg。(2)老年人(≥65岁)，根据肾功能状况，调整剂量。(3) 4～11岁的儿童和青少年（12～17岁）（体重≤50 kg者），起始治疗剂量是按体重10 mg/kg，一日2次。根据临床效果及耐受性，剂量可以增加至30 mg/kg，一日2次。剂量变化应以每2周一次增加或减少10 mg/kg，一日2次。应尽量使用最低有效剂量。儿童和青少年体重≥50 kg者，剂量和成人一致。(4) 青少年和儿童推荐剂量，起始剂量10 mg/kg，一日2次，最大剂量30 mg/kg，一日2次。体重15 kg，起始剂量一次150 mg，一日2次，最大剂量一次450 mg，一日2次。体重20 kg，起始剂量一次200 mg，一日2次，最大剂量一次600 mg，一日2次。体重25 kg，起始剂量一次250 mg，一日2次，最大剂量一次750 mg，一日2次。体重50 kg或以上，起始剂量一次50 mg，一日2次，最大剂量一次1 500 mg，一日2次。(5) 婴儿和<4岁的儿童患者，目前尚无相关的充足的资料。(6) 正在进行透析晚期肾病患者：一次500～1 000 mg，一日1次。服用第1日推荐负荷剂量为左乙拉西坦750 mg。透析后，推荐给予250～500 mg附加剂量。

【制剂与规格】左乙拉西坦片：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 1.0 g。

拉莫三嗪[保(乙)]

Lamotrigine

【适应证】用于简单及复杂部分性发作、原发性及继发性全身强直-阵挛性发作性患者单药治疗以及也可用于治疗合并有Lennox-Gastaut综合征的癫痫发作。

【注意事项】(1) 本品可由乳汁分泌，哺乳期妇女慎用。(2) 孕妇、心功能不全者、严重肝功能不全者及肾衰竭者慎用。(3) 年老人及体弱者剂量宜减半。(4) 不宜突然停药，以避免引起癫痫反弹发作。(5) 出现皮疹等过敏反应，应即停药。(6) 服药期间应避免驾车或操纵机器。(7) 在初始剂量用药的第1个月，应严密观察，防止出现自杀行为。自杀风险出现在癫痫伴抑郁及双相情感障碍的病人。

【禁忌证】对本品过敏者或过敏体质者。

【不良反应】早期可有皮疹、发热、淋巴结病变、颜面水肿、血液系统及肝功能的异常等过敏反应的表现，还可有头痛、眩晕、疲乏、嗜睡、失眠、抽搐、不安、共济失调、易激惹、攻击行为、自杀倾向、焦虑、精神错乱、幻觉、体重减轻、肝功能异常、恶心、呕吐、便秘、腹泻、腹胀、食欲减退，白细胞、中性粒细胞、血小板减少，贫血，全血细胞减少、

复视、视物模糊。有出现锥体外系症状、舞蹈症、手足徐动症的个案报道。也有使用本品加重帕金森病症状的报道。罕见肝衰竭、再生障碍性贫血、粒细胞缺乏、Stevens-Johnson 综合征、中毒性表皮坏死溶解（Lyell 综合征）、弥散性血管内凝血、多器官功能衰竭。

【用法与用量】口服：成人推荐量，对单药治疗（不与丙戊酸钠合用）者，第 1 ~ 2 周一次 25 mg，一日 1 次，第 3 ~ 4 周一次 50 mg，一日 1 次，通常维持量一日 100 ~ 200 mg，一日 1 次或分 2 次服用。对联合服用丙戊酸钠者，第 1 ~ 2 周一次 25 mg，隔日 1 次；第 3 ~ 4 周一次 25 mg，一日 1 次。以后每 1 ~ 2 周增加 25 ~ 50 mg，直至达到维持量一日 100 ~ 200 mg，分次服用。

【制剂与规格】拉莫三嗪片：① 25 mg；② 100 mg；③ 150 mg；④ 200 mg。

奥卡西平 [保（乙）]

Oxcarbazepine

【适应证】用于治疗成年人和 5 岁及 5 岁以上儿童的原发性全面性强直 - 阵挛发作伴有或不伴继发性全面发作和部分性发作。

【注意事项】(1) 本品与卡马西平可能存在交叉过敏。(2) 肝功能损害者慎用。(3) 孕妇应权衡利弊后使用，哺乳期妇女使用本品时应暂停哺乳。(4) 老年人用药易发生低钠血症。(5) 停用本品治疗时应逐减剂量，以避免诱发癫痫发作（发作加重或癫痫持续状态）。(6) 本品可引起眩晕及嗜睡，导致反应能力下降，服药期间应避免驾驶和操纵机器。(7) 出现低钠血症时，可减少本品用量、限制液体的摄人量或停药。多在停药几日后，血清钠浓度可恢复正常，无需其他治疗。

【禁忌证】对本品过敏者、房室传导阻滞者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、便秘、腹泻、腹痛、头痛、头晕、嗜睡、意识模糊、抑郁、感情淡漠、激动、情感不稳定、健忘、共济失调、注意力不集中、眼球震颤、复视和疲劳。少见白细胞减少、ALT 及 AST 升高、碱性磷酸酶升高。罕见过敏反应、关节肿胀、肌痛、关节痛、呼吸困难、哮喘、肺水肿、支气管痉挛。

【用法与用量】①癫痫的辅助治疗：起始量为一日 600 mg，分 2 次服。此后根据临床需要，一周增加 1 次剂量，一周最大增量为 600 mg，维持剂量为一日 1 200 mg，分 2 次服用（剂量超过 1 200 mg 时中枢神经系统不良反应增加）。②癫痫的单独治疗：由其他抗癫痫药物改为单用本品治疗时，起始剂量为一日 600 mg，分 2 次给药，同时其他抗癫痫药开始减量。可根据临床指征一周增加 1 次剂量，增量最大为一日 600 mg，直至最大剂量一日 2 400 mg。2 ~ 4 周达本品的最大剂量，而其他抗癫痫药应在 3 ~ 6 周逐渐减完。未用过任何抗癫痫药治疗者，本品的起始剂量为一日 600 mg，分 2 次给药。每 3 日增加 300 mg，直到一日 1 200 mg。③肾功能不全时，对肌酐清除率 < 30 ml/min 者，起始剂量为一日 300 mg，且增加剂量时间间隔不少于 1 周。④肝功能不全时剂量。轻至中度肝功能不全患者，无须调整剂量；重度肝功能不全患者用药还需进一步研究。⑤儿童用于癫痫辅助治疗。起始剂量按体重 8 ~ 10 mg/kg，分 2 次服，一日不超过 600 mg，在 2 周内达到维持剂量，体重为 20 ~ 29 kg 时，维持剂量为一日 900 mg；体重为 29.1 ~ 39 kg 时，维持剂量为一日 1 200 mg；体重 > 39 kg 时，维持剂量为一日 1 800 mg。

【制剂与规格】奥卡西平片：① 150 mg；② 300 mg；③ 600 mg。

加巴喷丁 [保（乙）]

Gabapentin

【适应证】用于成人和 12 岁以上儿童伴或不伴继发性全身发作的部分性癫痫发作的辅助治疗，也可用于 3 ~ 12 岁儿童的部分性发作的辅助治疗。

【注意事项】(1) 抗癫痫药不应突然停止服用，如换药或停药应逐渐减量，至少在 1 周内逐步进行。(2) 糖尿病患者应用时需经常监测血糖。(3) 肾功能不全的患者，服用本品必须减量（见用法与用量）。(4) 曾有服用本品发生出血性胰腺炎的报

告。因此，如出现胰腺炎的临床症状（持续性腹痛、恶心、反复呕吐），应立即停用本品。对慢性胰腺炎的患者，尚无充分的使用加巴喷丁的经验。(5) 本品作用于中枢神经系统，可引起镇静、眩晕或类似症状，也可降低反应速度，影响驾驶和操纵复杂机器的能力。(6) 妊娠期妇女只有在充分评估利益／风险后，才可使用。哺乳期妇女必须使用本品时，应停止哺乳或停用本品。

【禁忌证】已知对本品任一成分过敏者禁用。

【不良反应】常见嗜睡、疲劳、眩晕、头痛、恶心、呕吐、体重增加、紧张、失眠、共济失调、眼球震颤、感觉异常及厌食。偶见出现衰弱、视觉障碍（弱视、复视）、震颤、关节脱臼、异常思维、健忘、口干、抑郁及情绪化倾向。

【用法与用量】与其他抗癫痫药合用进行联合治疗。口服：从初始低剂量逐渐递增至有效剂量。12 岁以上患者在给药第 1 日可采用一日 1 次，一次 0.3 g；第 2 日为一日 2 次，一次 0.3 g，第 3 日为一日 3 次，一次 0.3 g，之后维持此剂量服用（见表 1-1）。3 ~ 12 岁的儿童开始剂量为一日按体重 10 ~ 15 mg/kg，分 3 次服，根据反应情况逐渐增加剂量，3 日后可增至一日 25 ~ 35 mg/kg，分 3 次服。

【制剂与规格】加巴喷丁胶囊（片）：① 0.1 g；② 0.3 g。

表 1-1 12 岁以上的患者依据肾功能状况调节给药剂量

肌酐清除率（每分钟毫升数）	一日总量 (g)	服用次数
> 60	1.2	3
30 ~ 60	0.6	2
15 ~ 30	0.3	1
< 15	0.15	隔日 1 次

苯巴比妥[基(基)] 见 1.12。

地西泮[基(基)] 见 1.12。

1.8.2 癫痫持续状态的药物治疗

癫痫持续状态的应急方案包括避免患者外伤的处置、吸氧等维持呼吸、稳定血压和纠正水电解质平衡等。如怀疑酗酒可考虑给予非口服的维生素 B_1 类药；如果是维生素 B_6 缺乏引起的癫痫发作应补充维生素 B_6。

严重的癫痫持续状态应立即静脉给予地西泮，如果再次发作则在 10 分钟后重复给药。静脉注射地西泮效佳。肌内注射或者以地西泮栓剂治疗癫痫发作则起效太慢。氯硝西泮也可作为替代治疗。

苯妥英钠可在心电监护下缓慢静脉注射，继以维持剂量静脉滴注。不推荐肌内注射苯妥英钠（吸收缓慢且不稳定）。

非惊厥性癫痫持续状态。紧急处理无抽搐的癫痫持续状态取决于患者的严重程度。如果未完全意识丧失，通常可继续口服抗癫痫药物治疗或者重新启用抗癫痫药。对口服抗癫痫药无效的患者或者意识完全丧失的患者，可按惊厥性癫痫持续状态的措施处理，很少需要麻醉。

氯硝西泮 用于癫痫持续状态时，可静脉注射（时间至少超过 2 分钟）或静脉滴注 1 mg，成人剂量为 1 mg，必要时可重复。儿童剂量是 0.5 mg。（其他见 1.12）

地西泮[基(基)] 用于癫痫持续状态、惊厥、中毒引起的惊厥时，可静脉注射，成人剂量 10 mg，注射速度保持在每分钟 3 ~ 5 mg，必要时 10 分钟后重复；12 岁以下儿童剂量 0.3 ~ 0.4 mg/kg，必要时 10 分钟后重复。直肠溶液的保留灌肠，成人和超过 10 kg 的儿童，0.5 mg/kg，最大剂量是 30 mg（老年人 0.25mg/kg，最高剂量是 15 mg）；必要时 15 分钟后重复。（其他见 1.12）

劳拉西泮 用于癫痫持续状态时，可静脉注射（大静脉），成人剂量 4 mg，如再次发作，10 分钟后可重复 1 次；儿童剂量 0.1 mg/kg（最大剂量为 4 mg），复发则 10 分钟后重复 1 次。（其他见 1.14）

苯巴比妥钠 用于癫痫持续状态时，剂量为按体重 10 mg/kg，可静脉注射，以注射用水稀释 1∶10 的溶液，速度慢于

100 mg/min；最大剂量为 1 g。（其他见 1.12）

苯妥英钠 用于癫痫持续状态、神经外科病变引起的癫痫时，可缓慢静脉注射或静脉滴注（监测血压和心电），癫痫持续状态，负荷量为 18 mg/kg，速度不超过每分钟 50 mg；此后应给予大约 100 mg 的维持量，每隔 6 ~ 8 小时给予 1 次，并监测血药浓度，速度和剂量根据体重调整；儿童负荷量为 18 mg/kg（新生儿 15 ~ 20 mg/kg，速度为每分钟 1 ~ 3 mg/kg）。另外，为避免局部刺激，一次静脉注射或静脉滴注前后都应用氯化钠注射液冲管。不推荐肌内注射。（其他见 1.8.1）

1.8.3 热性惊厥的药物治疗

热性惊厥是一种与年龄相关的特殊的癫痫发作，儿童高发年龄为 9 ~ 18 个月，首发年龄于 6 个月 ~ 3 岁。一般分为单纯性热性惊厥和复杂性热性惊厥。短暂热性惊厥只需要简单处理，温水擦浴或者给予解热镇痛药（如对乙酰氨基酚）。若呈持续惊厥（一次发作持续 30 分钟或 30 分钟以上）或周期性惊厥，或者已知危险的儿童发生此两种惊厥则存在脑损害的可能性的，需要积极治疗。首选药为地西泮，缓慢静脉注射，较为可取。由于栓剂吸收太慢，不适合使用。周期性预防治疗（即在发热初期给予抗惊厥治疗）只适用于少数儿童。可选择口服地西泮。对热性惊厥的长期抗癫痫预防治疗很少报道。抗癫痫治疗只需要考虑对本身存在长期或者复杂性热性惊厥的儿童应用，即首次癫痫发作时未满 14 个月或有神经系统异常或曾长期发生惊厥或者是局部抽搐的患儿。

1.9 头痛和神经痛及其用药

1.9.1 急性偏头痛及其药物治疗和预防

偏头痛（migraine）是一种原因不清、反复发作的单侧或双侧头痛为特征的疾病，持续时间 4 ~ 72 小时。典型的特征包括单侧性、搏动样、中至重度头痛，常规的日常活动如上楼可加重头痛，可伴有恶心、畏光或畏声。部分患者有视觉先兆。发作期的治疗应当以过去发作时对药物的治疗反应和发作的严重程度为指导用药。在发作早期，停止头痛是首要治疗。可选用麦角胺咖啡因 1 ~ 2 片口服，若不能停止头痛，半小时后可追加 1 ~ 2 片。一日用量不能超过 6 片，每周不能超过 12 片。过量易引起中毒，在心脑血管疾病患者中应避免使用。重度发作期则首选选择性 $5\text{-}HT_{1B/1D}$ 受体激动药如舒马曲坦、利扎曲普坦等。其他非甾体抗炎药，如阿司匹林、对乙酰氨基酚（最好是可溶或分散剂型）通常有效，有时可需联合应用镇吐药。

过度使用阿片类或是非阿片类镇痛药、5- 羟色胺激动药和麦角胺类药物治疗偏头痛可能会引起药物过量性偏头痛（镇痛药导致的头痛），因此在加用药物时要谨慎。

对存在如下情况的患者应考虑偏头痛的预防：① 1 个月之内至少有两次发作；②头痛频率增加；③对偏头痛采取合理治疗后仍然存在明显的不适；④对一些罕见的偏头痛类型及存在偏头痛型脑梗死风险的患者也应进行预防。

β 受体拮抗药，如普萘洛尔、纳多洛尔和阿替洛尔，对预防偏头痛均有效。

苯噻啶有较好预防偏头痛的作用，但可致体重增加。为避免过量服药而致的昏睡，应以小剂量开始逐渐加量。

丙戊酸钠（见 1.8）也可用于偏头痛的预防，起始剂量一次 300 mg，一日 2 次，必要时可以加量至一日 1.2 g，分次服用。

钙通道阻滞药对偏头痛有一定预防作用。常用氟桂利嗪（见 1.1.1）一次 5 ~ 10 mg，每晚 1 次，连续 2 个月为 1 个疗程。或尼莫地平（见 1.1.1.4）一次 20 ~ 40 mg，一日 3 次，连续 3 个月为 1 个疗程。

苯噻啶

Pizotifen

【适应证】用于预防和治疗先兆性和非先兆性偏头痛，其可减轻症状和发作次数。也可用于红斑性肢体痛、血管神经性水肿、慢性荨麻疹、皮肤划痕症及房性、室性期前收缩等。

【注意事项】驾驶员及高空作业者慎用。长期使用应注意血象变化。

【禁忌证】青光眼、前列腺增生者。

【不良反应】抗毒蕈碱样作用（极其罕见有闭角型青光眼），困倦、食欲增加、体重增加，偶见恶心、头晕，罕见焦虑、攻击性和抑郁，在儿童可能出现中枢神经系统刺激症状。

【用法与用量】口服：一次 0.5 ~ 1 mg，一日 1 ~ 3 次。为减轻嗜睡作用，第 1 ~ 3 日每晚服 0.5 mg，第 4 ~ 6 日一日中、晚各服 0.5mg，第 7 日开始一日早、中、晚各服 0.5mg。如病情基本控制，可酌情递减剂量。每周递减 0.5 mg 到适当剂量维持。如递减后，病情发作次数又趋增加，再酌情增量。

【制剂与规格】苯噻啶片：0.5 mg。

1.9.1.1 非甾体抗炎镇痛药

大多数偏头痛对非甾体抗炎镇痛药（如阿司匹林、对乙酰氨基酚）治疗反应良好，但在偏头痛发作时胃肠蠕动减弱会导致药物吸收不佳而不能发挥最大疗效，因此，应用分散片或泡腾片更好一些。非甾体抗炎药（如双氯芬酸和布洛芬）也可用于偏头痛的治疗。

去痛片[保（甲）]

Compund Aminopyrine Phenacetin Tablets

【适应证】用于发热，轻、中度疼痛。

【注意事项】孕妇及哺乳期妇女慎用。长期大量用药应定期监测骨髓造血功能、肝肾功能。

【禁忌证】对氨基比林、非那西丁、咖啡因、苯巴比妥过敏者。

【不良反应】氨基比林可引起白细胞严重减少，尤其是粒细胞减少。长期服用含非那西丁的复方制剂，可对肾脏造成损害，严重者可致肾乳头坏死、尿毒症等。使用本品后可出现高铁血红蛋白血症、过敏性皮炎、粒细胞缺乏、血小板减少及肝炎等。剂量过大可引起肝功能损害，严重者可致昏迷甚至死亡，亦可引起肾绞痛和急性肾衰竭。有长期服用本品引起中毒的报道。

【用法与用量】口服：①成人，必要时一次 1 ~ 2 片，一日 1 ~ 3 次。② 5 岁以上儿童，一次 0.5 ~ 1 片。

【制剂与规格】去痛片：每片含氨基比林 0.15 g、非那西丁 0.15 g、咖啡因 0.05 g、苯巴比妥 0.015 g。

米格来宁[保（乙）]

Antipyrine and Caffeine Citrate

【适应证】用于神经衰弱等。

【注意事项】当药品性状发生改变时禁止使用。

【禁忌证】对过敏者禁用。

【不良反应】可能引起皮疹、发绀、虚脱、粒细胞减少。

【用法与用量】口服：一次 1 片，必要时用 2 片，不得超过 2 片，根据需要一日 1 ~ 3 次。

【制剂与规格】米格来宁片：每片含安替比林 0.27 g、咖啡因 27 mg、枸橼酸 3 mg。

罗通定[保（乙）]

Rotundine

【适应证】用于消化系统疾病引起的内脏痛、一般性头痛、月经痛、分娩后宫缩痛，也用于紧张性疼痛或因疼痛所致的失眠。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女使用应权衡利弊。(2) 用于镇痛时，临床较多见患者出现嗜睡状态，因而驾驶、机械操作、运动员等人员应慎用。(3) 本品曾有发生过敏性休克与急性中毒反应，应引起重视。本品与中枢神经系统抑制药合用时应慎重，必要时可适当调整剂量。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】偶见眩晕、嗜睡、乏力、恶心等。

【用法与用量】口服：一次 30 ~ 60 mg，一日 3 次。用于助眠，一次 30 ~ 90 mg，睡前服。

【制剂与规格】罗通定片：① 30 mg；②60 mg。

1.9.1.2 麦角胺生物碱类

麦角胺生物碱因其吸收困难及其不良

反应，特别是恶心、呕吐、腹痛和肌痉挛等，使其治疗偏头痛的临床价值受限，使用时不能超过推荐剂量，两次重复使用间隔不能少于4日。为避免依赖性，麦角胺类的使用必须限制在1个月之内不超过2次，不能作为预防性用药。

麦角胺咖啡因[基（基）、保（甲）]

Ergotamine and Caffein

【适应证】用于治疗偏头痛，能减轻其症状，无预防和根治作用，只宜在头痛发作时短期使用。

【注意事项】老年人慎用。本品在偏头痛刚发作时即服效果最佳，在有先兆时服用效果更佳，在偏头痛发作后不宜服用。

【禁忌证】对本品过敏者、活动期溃疡病、甲状腺功能亢进、严重高血压、冠心病、闭塞性血栓性脉管炎、肝肾功能损害、孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】常见手、指（趾）、面部麻木和刺痛、足部和下肢肿胀、肌痛；少见焦虑或精神错乱、幻视、胸痛、胃痛、气胀等。大剂量可出现暂时性心律失常、局部水肿、瘙痒。

【用法与用量】口服：一次1～2片，如无效可间隔0.5～1小时后再服1～2片，一日总量不超过6片。

【制剂与规格】麦角胺咖啡因片：每片含酒石酸麦角胺1 mg、咖啡因100 mg。

双氢麦角胺[保（乙）]

Dihydroergotamine

【适应证】用于偏头痛急性发作及血管性头痛。

【注意事项】对其他麦角碱药物曾产生过依赖性者，存在脑血管意外的危险因素者慎用。

【禁忌证】(1) 对麦角生物碱过敏者。(2) 周围血管疾病者、心肌梗死、冠心病、未控制的高血压者，持续低血压、休克者，败血症患者。(3) 正使用其他血管收缩药或升压药者（可引起极度高血压），24小时内使用过麦角类药、美西麦角、5-$HT_{1B/1D}$受体激动药（如舒马普坦）等，血管外科手术后患者。(4) 妊娠及哺乳期妇女，偏瘫性或基底动脉性偏头痛患者。(5) 严重肝功能不全者。(6) 严重肾功能不全者。

【不良反应】可见恶心、呕吐、腹泻、水肿等。

【用法与用量】(1) 口服：一次1～3 mg，一日2～3次。(2) 肌内注射：一次1～2 mg，一日1～2次。

【制剂与规格】双氢麦角胺片：1 mg。

甲磺酸双氢麦角胺缓释胶囊：5 mg。

双氢麦角胺口服液：1 ml∶2 mg。

双氢麦角胺注射液：1 ml∶1 mg。

1.9.1.3 5-羟色胺受体激动药

5-$HT_{1B/1D}$激动药对急性偏头痛治疗有效，阿米替林作用于5-$HT_{1B/1D}$受体，因此经常被归为5-$HT_{1B/1D}$受体激动药，5-$HT_{1B/1D}$激动药可以用于头痛发作的稳定期和对常规镇痛药治疗失败的患者。

用于治疗偏头痛常用的5-$HT_{1B/1D}$激动药有舒马普坦、佐米曲普坦，舒马普坦也可用于丛集性头痛的治疗。

5-$HT_{1B/1D}$激动药在以下患者使用时应谨慎，如已患有冠心病、肝功能受损、妊娠和哺乳期妇女。5-$HT_{1B/1D}$激动药一般推荐单药治疗，最好不与其他治疗偏头痛药联合应用。本类药物禁用于缺血性心脏病，以往有过心肌梗死、冠脉痉挛的患者（包括变异型心绞痛）及难治型、重度高血压者。不良反应可见于身体任何部位的麻刺感、发热、压迫和发紧感、头晕、无力、疲倦、恶心、呕吐等。

舒马普坦[保（乙）]

Sumatriptan

【适应证】用于成人有先兆或无先兆偏头痛的急性发作。

【注意事项】(1) 有潜在心脏病及其易感人群，肝肾功能不全者，用本品出现过胸痛或有胸部紧迫感者，有癫痫病史或脑组织损伤者慎用。(2) 有冠心病风险因素者，首次使用应在医生的监护下进行。(3)用药后不宜驾驶或操作机器。(4)儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女不推荐应用。

【禁忌证】(1) 本品不得用于存在缺血性心脏病、缺血性脑血管病和缺血性外周血管病等疾病病史、症状和体征者。

(2) 正在使用或2周内使用过单胺氧化酶制剂者禁用。(3) 舒马普坦不得用于偏瘫所致头痛和椎基底动脉病变所致的头痛。(4) 24小时内用过任何麦角胺类药物或包含麦角胺的药物（如双氢麦角胺或二氢麦角新碱）的患者禁用舒马普坦。本品亦不得与其他5-HT_1激动药并用。(5) 本品禁用于严重肝功能损害的患者。(6) 对舒马普坦过敏者。(7) 未经控制的高血压患者。

【不良反应】可有急性心肌梗死、致命性心律失常（如心动过速、心室颤动）、冠状动脉痉挛、脑出血、蛛网膜下腔出血、脑梗死及胸、颈、喉、颌等部位的疼痛、紧缩感、压迫感、困重感等。少见眩晕、倦怠、偏头痛、头痛、呕吐、唾液分泌减少等。少数患者可出现血压升高甚至高血压危象。偶见腹泻、胃痛、心悸、心源性晕厥、血压下降、癫痫发作、鼻窦炎、过敏性鼻炎、上呼吸道感染症状、呼吸困难等。罕见诱发哮喘等。

【用法与用量】口服：单次口服的推荐剂量为50 mg，若服用1次后无效，不必再加服。如在首次服药后有效，但症状仍持续发作者可于2小时后再加服1次。若服用后症状消失，但之后又复发者，应待前次给药24小时后方可再次用药。单次口服的最大推荐剂量为100 mg。24小时内的总剂量不得超过200 mg。

【制剂与规格】琥珀酸舒马普坦片：①25mg；② 50 mg；③ 100 mg。

佐米曲普坦[保(乙)]

Zolmitriptan

【适应证】适用于伴有或不伴有先兆症状的偏头痛的急性期治疗。

【注意事项】(1) 儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女用药应权衡利弊，哺乳期妇女慎用。(2) 肝肾功能不全者、具有发生冠心病危险因素的患者、未确诊为偏头痛或目前症状不典型的偏头痛患者慎用。(3) 本品仅用于诊断明确的偏头痛患者，应注意排除其他潜在的严重神经系统疾病（如进行性脑血管意外、蛛网膜下腔出血等）。(4) 缺血性或血管痉挛性冠状动脉疾病患者、具有发生冠心病危险因素的患者，均应在严密的医生监护下给予首剂。(5) 本品可能致嗜睡，服药后不宜驾车或操纵机器。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 24小时内服用过麦角衍生物或其他5-HT受体激动药者、正在使用单胺氧化酶抑制药或停药不到2周者。(3) 未控制的高血压、周围血管疾病、缺血性心脏病、脑血管疾病患者、偏瘫性或基底动脉性偏头痛患者、症状性帕金森综合征者及冠状动脉血管痉挛者。

【不良反应】常见恶心、头晕、嗜睡、无力、潮热感、口干。少数患者可出现感觉异常或感觉障碍，咽喉部、颈部、四肢及胸部可出现沉重感、紧缩感或压榨感（心电图没有缺血改变的证据）。还可见肌痛、肌无力、感觉迟钝。

【用法与用量】口服：一次2.5 mg，再次发作偏头痛或偏头痛持续状态2小时后可以重复使用（使用2.5 mg未达到满意缓解的患者再次发作可以加量至5 mg），最大剂量24小时内不超过10 mg。

【制剂与规格】佐米曲普坦片：2.5 mg。
佐米曲普坦胶囊：2.5 mg。

利扎曲普坦（利扎曲坦）[保(乙)]

Rizatriptan

【适应证】成人有或无先兆的偏头痛急性发作，不用于预防偏头痛。

【注意事项】(1) 单次服用50 mg，常会出现镇静作用。(2) 肾功能不全者、从事机械操作者慎用。

【禁忌证】(1) 禁用于局部缺血性心脏病（如心绞痛、心肌梗死或有记录的无症状缺血）的患者。(2) 禁用于有缺血性心脏病、冠状动脉痉挛（包括Prinzmetal变异型狭心症或其他隐性心血管疾病等）症状、体征的患者。(3) 因本品能升高血压，故不易控制血压的高血压患者禁用。(4) 禁用于半身不遂或基底部偏头痛患者。(5) 禁止同时服用MAO抑制药，禁止在停服MAO抑制药2周内服用本品。(6) 对本品或任一组分过敏者禁用。

【不良反应】虚弱、易疲劳、嗜睡、有疼痛或压迫感及眩晕。极少发生意外事件，如冠状动脉痉挛、短暂性心肌缺血、心肌梗死、室性心动过速及心室颤动。

【用法与用量】口服：一次5～10mg，每次用药的时间间隔至少为2小时，一日最高剂量不得超过30mg。

【制剂与规格】苯甲酸利扎曲普坦胶囊（片）：5mg（以利扎曲普坦计）。

1.9.2 紧张性头痛及其药物治疗

紧张性头痛（tension headache）是慢性头痛患者中最常见的一种类型。发病年龄多为20～50岁，女性多见。确切的病因及发病机制尚不明确，头痛产生的主要因素是头颈部肌肉的紧张性收缩以及长期精神过度紧张与疲劳、焦虑、抑郁或强烈刺激引起高级神经功能紊乱。主要表现为轻到中度、以头颈后部为主的、弥漫性疼痛，并可扩展至肩背部。疼痛性质为压迫、沉重感或紧箍感。一般不伴有呕吐，可有畏光畏声。颅周肌肉可有压痛。

治疗原则如下。

（1）首先针对病因进行治疗。如纠正导致头颈部肌肉紧张性收缩的非生理性姿势，伴随情绪障碍者适当给予抗抑郁药。

（2）对于发作性紧张性头痛，阿司匹林、对乙酰氨基酚、罗通定、双氯芬酸、麦角胺咖啡因及5-$HT_{1B/1D}$胺激动药均有一定疗效。

（3）慢性紧张性头痛有较长的头痛史，常是心理疾患如抑郁、焦虑的表现之一，适当应用抗抑郁药。由于头痛的慢性特征，具有依赖性的镇痛药应当避免或短期使用。非甾体类抗炎镇痛药对缓解疼痛有良好疗效。具有肌肉松弛作用的巴氯芬及兼有肌肉松弛及抗焦虑作用的氯美扎酮也有一定疗效，但尚无紧张性头痛的适应证。对上述镇痛药疗效不明显者，也可使用曲马多、氨酚待因、可待因等药物。

巴氯芬 用于脊髓和大脑疾病或损伤引起的肌肉痉挛。口服。成人，第1～3日一次5mg，一日3次；第4～6日一次10mg，一日3次；第7～9日一次20mg，一日3次。以后可再渐增剂量，具体剂量应根据患者的反应进行调整。对本品作用敏感的患者，剂量递增应缓慢。常用剂量为一日30～75mg，但一日最大剂量不得超过80mg。（其他见7.3.3）

氯美扎酮[保（乙）]

Chlormezanone

【适应证】用于治疗精神紧张、恐惧、烦躁不安、失眠、酒精中毒、肌肉疼痛及痉挛、风湿性关节炎等。

【注意事项】（1）儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女慎用。（2）需集中精力工作人员慎用。

【禁忌证】对本品过敏者，驾车、操纵机器、高空作业人员。

【不良反应】常见疲倦、皮疹、眩晕、面部潮红、厌食、恶心、水肿、排尿困难、无力、头痛等；偶见黄疸；罕见多形红斑症。

【用法与用量】口服：用于治疗焦虑，一次200mg，一日3次。用于镇静催眠，一次200～400mg，睡前服。用于减缓疲劳及晕车、晕船，适时服用200mg。

【制剂与规格】氯美扎酮片：① 100mg；② 200mg。

1.9.3 神经痛及其药物治疗

神经痛（neuropathic pain）是神经组织受损而产生的痛觉反应，包括疱疹后疼痛、幻肢痛、复合性区域疼痛综合征、压迫性神经病、周围性神经病（如糖尿病引起、类风湿关节炎、酒精中毒）、外伤、中枢痛（如脑卒中后疼痛、脊髓外伤及脊髓空洞症）和特发性神经病。痛觉发生在感觉缺失区域，性质常被描述为烧灼样及刺痛，经常伴有痛觉过敏。

三叉神经痛也是由神经组织功能异常引起，但治疗与其他形式的神经痛不同。

神经痛可用三环类抗抑郁药和一些抗癫痫药治疗。对阿片类镇痛药仅部分有效。在阿片类镇痛药中，美沙酮、曲马多、羟考酮对神经痛最为有效，当其他治疗措施无效时可考虑使用上述药物，神经阻滞可能有所帮助。许多患有慢性神经痛的患者需要多学科管理，包括理疗及心理治疗。

加巴喷丁对神经痛有效。糖皮质激素有助于缓解压迫性神经病的神经受压而缓解疼痛。

此处主要介绍三叉神经痛的药物治疗。

卡马西平在三叉神经痛急性发作期，

可减少发作频率、降低疼痛的程度，是首选治疗药。使用时应从小剂量开始，以减少不良反应如头晕的发生。在给予较高剂量时应监测血细胞计数和电解质。另外，一些患者对苯妥英钠有效。

1.10 周围神经病及其用药

吉兰-巴雷综合征（Guillain-Barre syndrome，GBS）也称急性炎性脱髓鞘性多发性神经病（acute inflammatory demyelinating polyneuropathy，AIDP），属自身免疫性疾病。临床表现为迅速进展而大多数可恢复的四肢对称性迟缓性瘫痪，可累及脑神经和呼吸肌。脑脊液常有蛋白-细胞分离现象，病前常有非特异性感染或预防接种史等。

急性期患者，无免疫球蛋白过敏或先天性 IgA 缺乏等禁忌者，静脉注射大剂量人免疫球蛋白，是治疗 GBS 有效的手段。成人按体重一日 0.4 g/kg 计算，连续 5 日。

急性期无糖皮质激素禁忌者，可试用甲泼尼龙一日 500 mg 静脉滴注，连续 5 日或地塞米松一日 10 mg，静脉滴注，7 ~ 10 日后逐减剂量，以后改为泼尼松口服一次 30 ~ 50 mg，隔日服用。视病情逐渐减量，疗程在 1 个月左右。需要注意的是：大剂量激素对本病的疗效有待证实，因此，AIDP 患者不宜首先推荐应用。急性期还可应用足量 B 族维生素、辅酶 A、三磷腺苷等。

面神经麻痹（facial palsy），又称 Bell 麻痹（Bell palsy）是因茎突乳突的孔茎乳突内的面神经非特异性炎症所致的周围性面神经麻痹，其病因不清。

治疗应设法促使局部炎症、水肿及早消退，并促使面神经功能的恢复。一般使用糖皮质激素泼尼松，一日 50 ~ 60 mg，连续 5 ~ 6 日，然后逐渐减量，每天递减 5 ~ 10 mg，5 ~ 6 日减药完毕而停药。

疑有病毒感染所致者，应尽早联合使用阿昔洛韦一次 0.2 g，一日 5 次，连续 7 ~ 10 日。尚可应用 B 族维生素等药。

甲钴胺[保(乙)]

Mecobalamin

【适应证】(1) 周围神经病。(2) 因缺乏维生素 B_{12} 引起的巨幼细胞贫血的治疗。

【注意事项】(1) 如用 1 个月以上仍无效者，应停用。(2) 避免同一部位反复注射，且对新生儿、早产儿、婴儿、幼儿要特别小心。注意避开神经分布密集的部位。注意注射针扎入时，如有剧痛、血液逆流的情况，应立即拔出针头，换部位注射。(3) 妊娠及哺乳期妇女用药的安全性尚不明确。(4) 老年患者因身体功能减退，应酌情减少剂量。(5) 从事汞及其化合物工作的人员，不宜长期大量服用本药。(6) 给药时见光易分解，开封后立即使用的同时，应注意避光。为确保储存质量稳定，采用遮光保护袋，在使用时从遮光保护袋中取出。

【禁忌证】对本品成分过敏者。

【不良反应】可见血压下降、呼吸困难等严重过敏反应；其他，如皮疹、头痛、发热感、出汗、肌内注射部位疼痛、硬结。

【用法与用量】(1) 口服：成人，周围神经病，通常一次 500 μg，一日 3 次，可按年龄、症状酌情增减。(2) 肌内注射或静脉注射：成人，①周围神经病，通常一次 500 μg，一日 1 次。一周 3 次，可按年龄、症状酌情增减。②巨幼红细胞贫血，通常一次 500 μg，一周 3 次，给药约 2 个月后，作为维护治疗每隔 1 ~ 3 个月一次 500 μg。

【制剂与规格】甲钴胺片：500 μg。

甲钴胺胶囊：500 μg。

甲钴胺注射液：1 ml ∶ 500 μg。

1.11 注意缺陷多动障碍和抽动障碍及其药物治疗

1.11.1 注意缺陷多动障碍用药

注意缺陷多动障碍（attention deficit and hyperactivity disorder，ADHD）又称多动症，是指发生于儿童时期，与患儿年龄不相称的过度活动、注意力不集中、冲动任性、情绪不稳并伴有认知障碍和学

习困难的一组症候群，此类症状可延续到成年期而称为成人注意缺陷多动障碍。

目前，注意缺陷多动障碍药物治疗中首选中枢兴奋药哌甲酯和托莫西汀，作为综合治疗计划的一部分，哌甲酯和托莫西汀一般不会影响儿童的生长发育。治疗通常要持续到青春期，甚至可需持续到成年期。

哌甲酯[保(乙)]

Methylphenidate

【适应证】用于注意缺陷多动障碍。

【注意事项】(1) 妊娠、癫痫患者慎用（癫痫患者如发作频率增加，应停用）；当驾驶、操作机械或从事其他具有潜在危险性的活动时应慎用本品；长期治疗应监测生长发育、血压和全血细胞计数；避免突然停药；可能引起或者加重抽动 - 秽语综合征，因此在用药前应进行抽动症的临床评价，还应考虑患者的家族史。(2) 6岁以下儿童避免使用。

【禁忌证】青光眼，激动性抑郁，过度兴奋，对本品过敏者。

【不良反应】(1) 常见食欲减退、头晕、头痛、失眠、恶心、易怒等。(2) 严重的不良反应包括心律失常、自杀倾向、血尿、肌痛性痉挛、鼻出血、生长抑制、视觉障碍等。(3) 罕见肝损害、心肌梗死、大脑动脉炎、精神异常、恶性综合征（表现为肌紧张、高热、意识障碍、大汗、血压不稳）、白细胞减少症和血小板减少、闭角型青光眼、剥脱性皮炎、多形性红斑等。

【用法与用量】口服：成人一次 10 mg，一日 2 ~ 3 次，餐前 45 分钟服用。儿童（6 岁以上）一次 5 mg，一日 2 次，于早餐及午餐前服。以后根据疗效调整剂量，每周递增 5 ~ 10 mg，1 日总量不宜超过 40 mg。控释剂型必须整片吞服，不可咀嚼、掰开或压碎服用，作用维持 12 小时，早上服药一次，可有效控制白天的症状。

【制剂与规格】哌甲酯片：10 mg。

哌甲酯控释片：① 18 mg；② 36 mg；③ 54 mg。

托莫西汀[保(乙)]

Tomoxetine

【适应证】用于注意缺陷多动障碍。

【注意事项】以下情况慎用：心血管疾病包括高血压病、心动过速和心电图 QT 间期延长（应避免同时服用使心电图 QT 间期延长的药物）；癫痫发作史；长期用药应监测儿童的生长发育；中、重度肝功能不全者应酌情减量。

【禁忌证】闭角型青光眼；正在服用或在前 14 日内服用过单胺氧化酶抑制药（如苯乙肼、苯环丙胺等）的患者；对本品或其组分过敏者。

【不良反应】(1) 常见食欲减退、口干、恶心、呕吐、腹痛、便秘、消化不良、肠胃胀气、心悸、心动过速、血压升高等。(2) 严重的不良反应包括震颤、僵直、尿潴留、尿失禁、前列腺炎、性功能障碍、月经不调、自杀倾向、肢端发冷等。(3) 罕见的不良反应包括肝损害、癫痫发作、闭角型青光眼、雷诺病等。

【用法与用量】口服。青少年体重如在 70 kg 以上，起始剂量一日 40 mg，7 日后根据效果不断增加剂量，通常维持在一日 80 mg，最大剂量不超过一日 100 mg；6 周岁以上的儿童和体重在 70 kg 以下的青少年，起始剂量一日 0.5 mg/kg，7 日后根据效果增加剂量，通常维持在一日 1.2 mg/kg。治疗剂量可于早晨一次性给药或早、晚分 2 次给药。

【制剂与规格】托莫西汀胶囊：① 5 mg；② 10 mg；③ 18 mg；④ 25 mg；⑤ 40 mg；⑥ 60 mg。

1.11.2 抽动障碍用药

抽动障碍（tic disorders）是起病于儿童或青少年时期，以不自主的、反复的、快速的一个或多个部位运动抽动和发声抽动为主要特征的一组综合征。包括短暂性抽动障碍、慢性运动或发声抽动障碍、发声与多种运动联合抽动障碍（也称抽动 - 秽语综合征、Tourette 综合征）。

治疗抽动障碍的治疗常用药包括氟哌啶醇、盐酸硫必利等。

氟哌啶醇[基(基)] 用于抽动秽语综合征，也用于急、慢性精神分裂症、躁狂症，对控制兴奋躁动的情绪和攻击行为的效果较好。(1) 口服：治疗抽动秽语综合征，一次 1~2 mg，一日 2~3 次。(2) 肌内注射：治疗抽动秽语综合征，一次 2.5 ~ 5 mg，一日 2 ~ 3 次，安静后改为口服给药。(其他见 1.16)

硫必利[保(乙)]

Tiapride

【适应证】用于治疗抽动 - 秽语综合征，亦可用于舞蹈症、老年性精神运动障碍、头痛、痛性痉挛、神经肌肉疼痛等。

【注意事项】严重循环系统障碍、肝肾障碍、脱水营养不良患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 常见有嗜睡（发生率约为 2.5%)、溢乳、闭经（停药后可恢复正常)、消化道反应及头晕、乏力等。(2) 罕见有肌强直，心率加快，血压波动，出汗等综合征。

【用法与用量】口服：用于抽动 - 秽语综合征，开始一日 150 ~ 300 mg，分 3 次服，渐增至一日 300 ~ 600 mg；待症状控制后 2 ~ 3 个月，酌减剂量。维持量一日 150 ~ 300 mg。

【制剂与规格】盐酸硫必利片：100 mg。

1.12 失眠症及其药物治疗

失眠症（insomnia）是一种持续相当长时间的睡眠的质和（或）量令人不满意的状况。在失眠者中，难以入睡是最常见的主诉，其次是维持睡眠困难和早醒。一个人如果长期失眠，就会对失眠越来越恐惧，感到紧张、焦虑、担心或抑郁，形成了一个恶性循环。失眠症除以药物治疗外，尚应包括心理治疗、良好的睡眠生理习惯的培养。

心理因素在失眠症的形成过程中关系密切，往往开始时是由于某种原因引起失眠，以后因怕失眠而在入睡前产生焦虑，加重了失眠症状。因此，首先要消除焦虑情绪，学会放松自己，建立自信心。注意睡眠生理并养成良好习惯。

催眠药包括巴比妥类、苯二氮䓬类和其他 3 类药物。

(1) 巴比妥类药：苯巴比妥、司可巴比妥等。

(2) 苯二氮䓬类药：地西泮、硝西泮、氟西泮、阿普唑仑、奥沙西泮、劳拉西泮、艾司唑仑、氯硝西泮等。

(3) 其他类药：唑吡坦、佐匹克隆等。

巴比妥类药具有依赖性，尤其是中、短效的巴比妥类药更为明显。因此，目前巴比妥类已不作为首选药，且不建议长期使用。苯二氮䓬类药也具有一定的依赖性，尤其是作用快速的药物如三唑仑、咪达唑仑、硝西泮等，依赖性更为明显。有学者认为，只要使用时间过长，无论种类或剂量多少均可形成明显的药物依赖。

苯二氮䓬类药对儿童特别是幼儿的中枢神经异常敏感，新生儿不易将本类药代谢为无活性的产物，因此中枢神经可持久的抑制。处方催眠药给儿童除了偶尔用于夜间恐惧和睡行症，其他使用均为不合理。

老年人用催眠药可能出现共济失调和意识混乱，并且因此容易摔倒和受伤，故应慎用并告知注意事项。

苯巴比妥[基(基)，保(甲)]

Phenobarbital

【适应证】用于治疗焦虑、失眠、癫痫及运动障碍。

【注意事项】(1) 新生儿服用本品可发生低凝血酶原血症及出血，维生素 K 有治疗或预防作用。(2) 神经衰弱者、甲状腺功能亢进、糖尿病、严重贫血、发热、临产及产后、轻微脑功能障碍、低血压、高血压、肾上腺功能减退、高空作业、精细和危险作业者、老年患者慎用。(3) 作为催眠治疗，应以几种作用机制不同的药物交替服用，长期服用者不可突然停药。(4) 过敏体质者服用后可出现荨麻疹、血管神经性水肿、皮疹及哮喘等，甚至可发生剥脱性皮炎。

【禁忌证】严重肺功能不全、肝硬化、卟啉病、贫血、未控制的糖尿病、过敏等。

【不良反应】可有过敏性皮疹、环形红斑，眼睑、口唇、面部水肿；严重者发生剥脱性皮炎和 Stevens-Johnson 综合征；

老年、儿童和糖尿病患者可发生意识模糊，抑郁或逆向反应（兴奋）；也可见粒细胞减少、低血压、血栓性静脉炎、血小板减少、黄疸、骨骼疼痛、肌肉无力等、笨拙或步态不稳、眩晕或头晕、恶心、呕吐、语言不清；突然停药后发生惊厥或癫痫发作、晕厥、幻觉、多梦、梦魇、震颤、不安、入睡困难等，则提示可能为撤药综合征。

【用法与用量】(1) 口服：①成人。催眠，30 ~ 100 mg，晚上一次顿服。镇静，一次 15 ~ 30 mg，一日 2 ~ 3 次。抗癫痫，一次 15 ~ 30 mg，一日 3 次。抗惊厥，一日 90 ~ 180 mg，晚上一次顿服；或一次 30 ~ 60 mg，一日 3 次。极量：一次 250 mg，一日 500 mg。老年人或虚弱患者应减量。②儿童，用药应个体化。镇静，按体重一次 2 mg/kg，或 60 mg/m^2，一日 2 ~ 3 次。抗癫痫，按体重一次 2 mg/kg，一日 2 次。抗惊厥，按体重一次 3 ~ 5 mg/kg。(2)肌内注射：①成人常用量。催眠，一次 100 mg；极量一次 250 mg，一日 500 mg；②儿童常用量。镇静、抗癫痫，一次 16 ~ 100 mg。(3) 静脉注射：癫痫持续状态，成人，一次 100 ~ 250 mg，必要时 6 小时重复 1 次。剂量一次 250 mg，一日 500 mg，注射应缓慢。

【制剂与规格】苯巴比妥片：① 15 mg；② 30 mg；③ 100 mg。

注射用苯巴比妥钠：① 50 mg；② 100 mg；③ 200 mg。

异戊巴比妥[保(乙)]

Amobarbital

【适应证】用于催眠、镇静、抗惊厥（小儿高热惊厥、破伤风惊厥、子痫、癫痫持续状态）和麻醉前给药。

【注意事项】(1) 对一种巴比妥过敏者，可能对本品过敏。(2) 肝功能不全者，用量应从小量开始。(3) 不宜长期用药，如连续使用达 14 日可出现快速耐药性。(4) 长期用药可产生精神或躯体依赖性，停药需逐渐减量，以免引起撤药症状。(5) 与其他中枢抑制药合用，可产生协同抑制作用。(6) 下列情况慎用：轻微脑功能障碍症、低血压、高血压、贫血、甲状腺功能低下、肾上腺功能减退、心肝肾功能损害、高空作业、驾驶员、精细和危险工种作业者。(7) 本药可通过胎盘，妊娠期长期服用，可引起依赖性及致新生儿撤药综合征；由于维生素 K 含量减少可能引起新生儿出血；妊娠晚期或分娩期应用，由于胎儿肝功能尚未成熟引起新生儿（尤其是早产儿）的呼吸抑制；用于抗癫痫可能产生胎儿致畸。哺乳期应用可引起婴儿的中枢神经系统抑制。(8) 儿童用药可能引起反常的兴奋，应注意。(9) 老人用药对本药的常用量可引起兴奋神经错乱或抑郁，因此用量宜较小。

【禁忌证】严重肺功能不全、肝硬化、血卟啉病史、贫血、哮喘史、未控制的糖尿病、对本品过敏的患者禁用。

【不良反应】(1) 可能引起微妙的情感变化，出现认知和记忆的缺损。(2) 长期用药，偶见叶酸缺乏和低钙血症。(3) 罕见巨幼红细胞性贫血和骨软化。(4) 大剂量时可产生眼球震颤、共济失调和严重的呼吸抑制。(5) 多见各种皮疹以及哮喘，严重者可出现剥脱性皮炎和多形性红斑，中毒性表皮坏死极为罕见。(6) 有报道用药者出现肝炎和肝功能紊乱。

【用法与用量】深部肌内注射（不能用于浅表）或静脉注射：成人常用量：用于催眠一次 100 ~ 200 mg；镇静一次 30 ~ 50 mg，一日 2 ~ 3 次；抗惊厥（常用于治疗癫痫持续状态），缓慢静脉注射 300 ~ 500 mg。成人极量一次 250 mg，一日 500 mg。小儿常用量：催眠或抗惊厥，肌内注射，每次按体重 3 ~ 5 mg/kg，或按体表面积 125 mg/m^2；镇静每日 6 mg/kg，分 4 次给予。

【制剂与规格】注射用异戊巴比妥钠：① 100 mg；② 250 mg；③ 500 mg。

司可巴比妥[保(乙)]

Secobarbital

【适应证】适用于不易入睡的患者。也可用于抗惊厥（如破伤风等）。

【注意事项】(1) 对一种巴比妥类药过敏者，可能对本品过敏。(2) 轻微脑功能障碍症、低血压、高血压、贫血、甲状腺功能减退、肾上腺功能减退、心肝肾功能

损害、高空作业、驾驶员、精细和危险工种作业者慎用。(3) 作抗癫痫药应用时，可需10～30日能达到最大效果，需按体重计算药量，如有可能应定期测定血药浓度，以达最大疗效。(4) 肝功能不全者，用量应从小量开始。(5) 长期用药可产生精神或躯体的药物依赖性，停药需逐渐减量，以免引起撤药症状。(6) 与其他中枢抑制药合用，对中枢神经可产生协同的抑制作用。

【禁忌证】严重肺功能不全、肝硬化、血卟啉病史、贫血、哮喘史、未控制的糖尿病、对本品过敏者禁用。

【不良反应】见苯巴比妥。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量。催眠，50～200 mg，睡前一次顿服；镇静，一次30～50 mg，一日3～4次；麻醉前用药200～300 mg，术前1小时服。成人极量一次300 mg。②小儿常用量。镇静，每次按体重2 mg/kg，或按体重表面积60 mg/m²，一日3次；麻醉前用药，50～100 mg，术前1小时给药。(2) 静脉注射：用于麻醉前催眠，一次不超过250 mg，速度不超过每分钟200 mg (不超过15秒50 mg)。

【制剂与规格】司可巴比妥钠胶囊：100 mg。

注射用司可巴比妥钠：100 mg。

地西泮[基(基)、保(甲)]

Diazepam

【适应证】用于焦虑、镇静催眠、抗癫痫和抗惊厥，并缓解炎症所引起的反射性肌肉痉挛等；也可用于治疗惊恐症、肌紧张性头痛，家族性、老年性和特发性震颤，或麻醉前给药。

【注意事项】(1) 对某一苯二氮䓬类药过敏者，对其他同类药也可能过敏。(2) 中枢神经系统处于抑制状态的急性酒精中毒、昏迷或休克时注射地西泮可延长半衰期，有药物滥用或依赖史；肝、肾功能损害可延长半衰期，严重的精神抑郁可使病情加重，甚至产生自杀倾向，应采取预防措施；本品可使伴呼吸困难的重症肌无力患者的病情加重；急性或隐性闭角型青光眼发作，因本品可能有抗胆碱效应；严重慢性阻塞性肺部病变，可加重通气衰竭。(3) 本类药可通过胎盘屏障。在妊娠初期3个月内，地西泮有增加胎儿致畸的危险，其他苯二氮䓬类也有此可能，除用作抗癫痫外，在此期间尽量勿用。妊娠期妇女长期使用可引起依赖，使新生儿呈现撤药症状，并可使新生儿中枢神经活动有所抑制，在分娩前或分娩时使用本类药，可导致新生儿肌张力软弱。地西泮及其代谢产物可分泌入乳汁，氯硝西泮、氟西泮、奥沙西泮及其代谢产物也有此可能，由于新生儿代谢较成人慢，乳母服用可使婴儿体内本品及其代谢产物积聚。(4) 老年、体弱、幼儿、肝病和低蛋白血症患者对本类药的中枢性抑制较敏感，静脉注射给药时容易引起呼吸抑制、低血压、肌无力、心动过缓或心搏停止。高龄衰老、危重、肺功能不全及心血管功能不稳定等患者，静脉注射过快或与中枢抑制药合用时，发生率更高，情况也更严重。(5) 在分娩前15小时内应用本品30 mg以上，尤其是肌内或静脉注射，可使新生儿窒息、肌张力减退、低温、厌食、对冷刺激反应微弱并抑制代谢。(6) 静脉注射易发生静脉血栓或静脉炎。(7) 静脉注射过快给药可导致呼吸暂停、低血压、心动过缓或心搏停止。(8) 治疗癫痫时，可能增加癫痫大发作的频度和严重度，需要增加其他抗癫痫药的用量，突然停用也可使癫痫发作的频度和严重度增加。(9) 原则上不应做连续静脉滴注，但在癫痫持续状态时例外。(10) 本品有可能沉淀在静脉输液器管壁上，或吸附在塑料输液袋的容器和导管上。(11) 分次注射时，总量应从初量算起。(12) 长期使用本品，停药前应逐渐减量，不要骤停。(13) 超量指征有持续的精神紊乱，嗜睡深沉，震颤，持续的说话不清，站立不稳，心动过缓，呼吸短促或困难，严重的肌无力。氟马西尼是本类药的拮抗药，遇有超量或中毒，可使用本品拮抗，并宜及早进行对症处理，包括催吐或洗胃等，以及呼吸和循环方面支持疗法。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠期妇女、新生儿。

【不良反应】常见嗜睡、乏力等，大剂量可有共济失调、震颤。罕见皮疹、白

细胞减少；个别患者发生兴奋、多语、睡眠障碍甚至幻觉；本品有依赖性；长期应用后停药，可能发生撤药症状，表现为激动或抑郁，精神症状恶化，甚至惊厥；本品静脉注射速度宜慢，否则可引起心脏停搏和呼吸抑制；本品静脉注射用于口腔内镜检查时，若有咳嗽、呼吸抑制、喉头痉挛等反射活动，应同时应用局部麻醉药。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量。抗焦虑，一次 2.5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 4 次。癫痫发作，一次 2.5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 4 次。镇静、催眠、急性酒精戒断，第一日 1 次 10 mg，一日 3 ~ 4 次，以后按需要减少到一次 5 mg，一日 3 ~ 4 次。老年或体弱患者应减量。②儿童常用量。6 个月以下不用；6 个月以上儿童，一次 1 ~ 2.5 mg 或按体重 40 ~ 200 μg/kg 或体表面积 1.17 ~ 6 mg/m^2，一日 3 ~ 4 次，用量根据情况酌量增减。最大剂量不超过 10 mg（4 片）。(2) 肌内或静脉注射：①成人常用量。基础麻醉或静脉全麻，10 ~ 30 mg。镇静、催眠或急性乙醇戒断，开始 10 mg，以后按需每隔 3 ~ 4 小时加 5 ~ 10 mg，24 小时总量以 40 ~ 50 mg 为限。癫痫持续状态和严重复发性癫痫，开始静注 10 mg，每间隔 10 ~ 15 分钟可按需增加甚至达最大量。破伤风时可能需要较大剂量。老年和体弱患者，肌内注射或静注时用量减半。静脉注射宜缓慢，每分钟 2 ~ 5 mg。②儿童常用量。抗癫痫、癫痫持续状态和严重复发性癫痫时，常用方法为 < 5 岁的儿童，肌内或静脉注射（以静脉注射为宜），每 2 ~ 5 分钟 0.2 ~ 0.5 mg，最大限用量 5 mg；5 岁以上儿童，肌内或静脉注射（以静脉注射为宜），每 2 ~ 5 分钟 1 mg，最大限用量 10 mg。如需要，在 2 ~ 4 小时可重复上述剂量治疗。重症破伤风解痉时，< 5 岁 1 ~ 2 mg，必要时 3 ~ 4 小时重复注射，5 岁以上注射一次 5 ~ 10 mg。儿童静注宜缓慢，3 分钟内按体重不超过 0.25 mg/kg，间隔 15 ~ 30 分钟后可重复。新生儿应慎用。

【制剂与规格】地西泮片：① 2.5 mg；② 5 mg。

地西泮注射液：2 ml : 10 mg。

艾司唑仑 [基（基）、保（甲）]

Estazolam

【适应证】用于失眠、焦虑、紧张、恐惧，也可用于抗癫痫和抗惊厥。

【注意事项】见地西泮。

【不良反应】服用量过大可出现轻微乏力、口干、嗜睡。持续服用后亦可出现依赖，但程度较轻。

【用法与用量】口服：成人用于镇静，一次 1 ~ 2 mg，一日 3 次；用于失眠，1 ~ 2 mg，睡前服；用于抗癫痫、抗惊厥，一次 2 ~ 4 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】艾司唑仑片：① 1 mg；② 2 mg。

硝西泮 [保（乙）]

Nitrazepam

【适应证】用于治疗失眠及抗惊厥、抗癫痫药。

【注意事项】见地西泮。

【禁忌证】呼吸抑制者、显著的神经肌肉呼吸无力，包括不稳定的重症肌无力，急性肺动脉关闭不全、严重肝损害、睡眠呼吸暂停综合征，不能单一用于治疗抑郁（或者与抑郁相关的焦虑）或慢性精神疾病。

【不良反应】(1) 嗜睡、宿醉、头晕、视物不清、呼吸抑制、意识障碍、共济失调（尤其在老年人中）。(2) 儿童大量服用可有黏液和唾液分泌增多。(3) 长期使用可有轻度依赖性。(4) 服用一段时间后突然停药，可出现反跳性失眠。(5) 可出现记忆减退。

【用法与用量】口服：用于失眠，成人一次 5 ~ 10 mg，睡前服用；用于癫痫，一次 5 ~ 10 mg，一日 3 次（或渐增加至可以耐受的有效量），老年或体弱患者剂量减半。

【制剂与规格】硝西泮片：5 mg。

氟西泮

Flurazepam

【适应证】用于各种失眠，如入睡困难、夜间多梦、早醒，对反复发作的失眠或睡眠障碍以及需睡眠休息的急慢性疾病均有

疗效。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见硝西泮。

【用法与用量】口服：成人常用量，15 ~ 30 mg，睡前服用。老年或体弱患者，从小量 7.5 mg 开始，后按需调整。15 岁以下儿童的效果和安全性尚未确定。

【制剂与规格】氟西泮胶囊：①15 mg；② 30 mg。

唑吡坦 [保（乙）]

Zolpidem

【适应证】用于偶发失眠和暂时失眠患者。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者，本品的血浆清除时间可延长。(2) 急性酒精中毒者应用时可发生致命危险。(3) 有酒精或药物滥用、依赖史者，对本品可能产生依赖性。(4) 有精神抑郁者，唑吡坦可使症状加重。(5) 严重慢性阻塞性肺病或有睡眠呼吸暂停综合征者，可加重疾病的症状。(6) 过量症状为严重的共济失调、心动过缓、复视、头晕、嗜睡、恶心、呕吐、呼吸困难、严重者可引起昏迷。

【禁忌证】有过敏史者、严重呼吸功能不全、睡眠呼吸暂停综合征、严重及急慢性肝功能不全者、肌无力者。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、头晕、头痛、困倦、衰弱、记忆减退、记忆障碍、噩梦、夜间坐立不安、抑郁、意识障碍、知觉障碍或复视、震颤、共济失调、摔倒、皮肤反应、性功能障碍等。

【用法与用量】口服：开始应服用最低有效剂量，成人最大剂量一次 10 mg，老年人及肝肾功能不全者，一次 5 mg，睡前服用，治疗时间最长不超过 4 周。

【制剂与规格】唑吡坦片：①5 mg；② 10 mg。

佐匹克隆 [保（乙）]

Zopiclone

【适应证】用于失眠。

【注意事项】(1) 本品可由乳汁分泌，其浓度随血浆药物浓度而变化，哺乳期妇女不宜使用。(2) 大量长期用药突然停药可引起戒断症状。困倦可能延续到第 2 日，影响驾驶、操作机械、高空作业等。(3) 肌无力者需进行监护，呼吸、肝肾功能不全者应调整剂量。(4) 连续用药时间不宜过长，突然停药时应进行监护。(5) 服用期间应严禁饮酒，乙醇的效应可被增强。(6) 15 岁以下儿童不宜应用。

【禁忌证】重症肌无力、失代偿呼吸功能不全者、严重睡眠呼吸暂停综合征者，对本品过敏者。

【不良反应】常见味觉障碍；少见胃肠功能障碍（恶心、呕吐）、口干、眩晕、困倦、头痛；偶见轻度头晕、共济失调、过敏、攻击倾向、意识障碍，抑郁、幻听、噩梦、记忆减退。

【用法与用量】口服：成人一次 7.5 mg，老年和体弱或肝功能不全患者一次 3.75 mg，睡前服用。

【制剂与规格】佐匹克隆片：7.5 mg。

右佐匹克隆 [保（乙）]

Dexzopiclone

【适应证】用于失眠。

【注意事项】(1) 右佐匹克隆应在临睡前服用。(2) 服用镇静催眠药有可能产生短期记忆损伤、幻觉、协调障碍、头晕眼花。老年患者或虚弱患者使用镇静催眠药应考虑到重复使用或对药物敏感引起的运动损伤和（或）认知能力损伤。(3) 妊娠及哺乳期妇女慎用。有关 18 岁以下儿童用药的安全性、有效性尚未确立，不推荐服用。

【禁忌证】对本品及其成分过敏者、失代偿的呼吸功能不全患者、重症肌无力、重症睡眠呼吸暂停综合征患者禁用。

【不良反应】主要不良反应为口苦和头晕，其他如瞌睡、乏力、恶心和呕吐等轻度消化系统和中枢神经系统的不良反应一般持续时间短，症状轻微，可自行缓解。

【用法与用量】口服：本品应个体化给药，成年人推荐起始剂量为入睡前 2 mg，由于 3 mg 可更有效的延长睡眠时间，可根据临床需要起始剂量为或增至 3 mg。主诉入睡困难的老年患者推荐起始剂量为睡前 1 mg，必要时可增至 2 mg。睡眠维持障碍的老年患者推荐剂量为入睡前 2 mg。特殊人群：严重肝损患者应慎重使用本品，初始剂量为 1 mg。与

CYP3A4 强抑制药合用，本品初始剂量不应大于 1 mg；必要时可增至 2 mg。

【制剂与规格】右佐匹克隆片：3 mg。

扎来普隆[保（乙）]

Zaleplon

【适应证】用于入睡困难的失眠症的短期治疗。

【注意事项】(1) 本品为第二类精神药品，须严格在医师指导下使用。(2) 不要超过医师指定的使用期限，长期服用可能会产生依赖性。有药物滥用史的患者慎用。(3) 在服用本品后，如发现行为和精神异常，请和医师联系。(4) 当服用扎来普隆或其他安眠药期间，禁止饮酒。(5) 除非能保证 4 个小时以上的睡眠时间，否则不要服用本品。(6) 没有医师的指导，不要随意增加本品的用量。(7) 驾车、操作机器者慎用。(8) 停药后的第一或两个晚上，可能有入睡困难。(9) 应尽可能少的给予抑郁症患者药物的数量，以防止过量的发生。(10) 本品起效快，应在上床前立即服用，或上床后难以入睡时服用。(11) 不要在用完高脂肪的饮食后立即服用本品。(12) 本品的不良反应与剂量相关，应尽可能用最低剂量，特别是老年人。(13) 用与下列药物联合使用时，可能因协同作用而加重后遗作用，导致清晨仍嗜睡。这些药物包括：用于治疗精神性疾病的药物（如中枢神经抑制药、抗精神病药、催眠药、抗焦虑药、镇静药、抗抑郁药），麻醉药和用于治疗变态反应的药物（如镇静抗组胺药）。

【禁忌证】对本品过敏者，严重肝、肾功能不全者，睡眠呼吸暂停综合征患者，重症肌无力患者，严重的呼吸困难或胸部疾病患者，哺乳期妇女及将要或已经妊娠妇女，儿童（小于 18 岁者）等禁用。

【用法与用量】口服：成人 5～10 mg，睡前服用或入睡困难时服用。体重较轻的患者，推荐剂量为一次 5 mg。老年病人、糖尿病患者和轻、中度肝功能不全的患者，推荐剂量为一次 5 mg。每晚只服用 1 次。持续用药时间限制在 7～10 日。如果服用 7～10 日后失眠仍未减轻，医师应对患者失眠的病因重新进行评估。

【制剂与规格】扎来普隆片：5 mg。

1.13 抑郁症及其药物治疗

抑郁症（depression）是一种常见的精神障碍，以持续的心境恶劣与情绪低落、兴趣缺失、精力不足等为主要临床特征，常伴随认知或精神运动障碍或躯体症状等。根据抑郁发作的严重程度分为轻度、中度及重度。

抗抑郁药不仅能治疗各类抑郁症，而且对焦虑、强迫、慢性头痛、疑病及恐怖等都有一定疗效。抗抑郁药根据化学结构及作用机制的不同分为以下几类：①选择性 5-HT 再摄取抑制药（SSRIs），如氟西汀、帕罗西汀、舍曲林、氟伏沙明、西酞普兰、艾司西酞普兰；② 5-HT 及去甲肾上腺素再摄取抑制药（SNRI），如文拉法辛；③去甲肾上腺素能及特异性 5-HT 能抗抑郁药（NSSA），如米氮平；④ 5-HT 受体拮抗药/再摄取抑制药（SARI），如曲唑酮；⑤四环类抗抑郁药，如马普替林；⑥三环类抗抑郁药，如阿米替林、氯米帕明、多塞平；⑦单胺氧化酶抑制药（MAOI），如氯贝胺；⑧其他，如噻萘普汀、贯叶连翘提取物等。各种抗抑郁药对抑郁症均有较好的疗效，传统的三环类抗抑郁药疗效明确，但因作用位点多，易产生多种不良反应，目前不建议首选。

抗抑郁药的用药原则如下

(1) 因人而异使用抗抑郁药，须全面考虑患者症状特点、年龄、躯体状况、药物的耐受性、有无并发症，予以个体化合理用药。

(2) 使用抗抑郁药时，应该从小剂量开始，逐步递增剂量，尽可能采用最小有效量，使不良反应减至最少，以提高服药依从性。当小剂量疗效不佳时，可根据药品不良反应和患者对药物的耐受情况，逐渐增至足量（有效剂量上限）。

(3) 药物起效都需要一定时间，大多数药物起效时间较慢，需要足够长的疗程，一般 4～6 周方显效，即便是起效较快的抗抑郁药如米氮平和文拉法辛，也需要 1 周左右的时间，因此要有足够的耐心，切忌频繁换药。

（4）换用抗抑郁药时要谨慎，只有在足量、足疗程使用某种抗抑郁药物仍无效时，方可考虑换用同类另一种或作用机制不同的另一类药物。换用不同种类的抗抑郁药物时，应该停留一定的时间，以利于药物的清除，防止药物相互作用。氟西汀需停药 5 周才能换用单胺氧化酶抑制药，其他 5-HT 再摄取抑制药需 2 周。单胺氧化酶抑制药在停用 2 周后才能换用 5-HT 再摄取抑制药。

（5）单一使用。使用抗抑郁药应尽可能单一用药，以避免发生药物相互作用，只有在足量、足疗程单一用药治疗无效时，方可考虑两种作用机制不同的抗抑郁药联合使用。一般情况不主张联用两种以上抗抑郁药。

（6）治疗期间应该密切观察病情变化和不良反应，倘若患者的经济条件允许，最好使用每日服用一次、不良反应轻微、起效较快的新型抗抑郁药，如 5-HT 再摄取抑制药类的氟西汀、帕罗西汀、舍曲林等，5- 羟色胺及去甲肾上腺素再摄取抑制药类的文拉法辛，NE 及特异性 5-HT 能抗抑郁药类的米氮平等。

（7）注意 SSRIs 与其他药物可能发生的代谢性相互作用。

1.13.1 选择性 5-HT 再摄取抑制药

使用选择性 5-HT 再摄取抑制药（SSRIs）时应注意，癫痫（如癫痫控制不良，请避免使用，如有惊厥发作，停止使用）、心脏病、糖尿病、闭角型青光眼、有躁狂病史、出血性疾病（尤其是胃肠道出血）、正在服用增加出血风险药物的患者慎用。驾驶车辆、高空作业、操纵机器人员应慎用。目前尚无有关和电休克联合治疗的有效资料，有少量报道正服用 SSRIs 患者可延长 ECT 治疗诱发的癫痫发作和（或）继发癫痫。药品安全委员会（CSM）建议在使用该类药物时应密切观察患者的自杀观念和自伤行为。

轻中度肝功能不全者应减少初始剂量，根据反应逐渐将剂量加大；明显肝功能不全患者慎用；明显肾功能不全患者慎用；妊娠期服用该类药物的安全性尚未确定，因此妊娠期或哺乳期妇女不宜服用，除非在利大于弊时方可使用。

选择性 5-HT 再摄取抑制药如迅速停药，可出现胃肠道紊乱、头晕、感觉障碍、睡眠障碍、恶心、出汗、激惹、震颤、意识模糊等，其中出汗是突然停药或大剂量减药的最常见症状。建议在停止治疗前逐渐减量。

选择性 5-HT 再摄取抑制药与单胺氧化酶抑制药合用可引起 5-HT 综合征，表现为不安、肌阵挛、腱反射亢进、多汗、震颤、腹泻、高热、抽搐和精神错乱，严重者可致死。因此服用氟西汀的患者至少停药 5 周后才可服用单胺氧化酶抑制药，其余该类药物至少停药 2 周后才可服用单胺氧化酶抑制药。其他 SSRI 类抗抑郁药的药物相互作用请见相关部分介绍。

对选择性 5-HT 再摄取抑制药及其赋形剂过敏者、正在服用单胺氧化酶抑制药的患者禁用。

氟西汀 [保（乙）]

Fluoxetine

【适应证】用于抑郁症、强迫症、神经性贪食症。

【注意事项】【禁忌证】见 SSRIs。

【不良反应】(1) 常见畏食、焦虑、腹泻、倦怠、头痛、失眠、恶心等，偶见诱发癫痫发作。(2) 少见咳嗽、胸痛、味觉改变、呕吐、胃痉挛、食欲减退或体重下降、便秘、视力改变、多梦、注意力涣散、头晕、口干、心率加快、乏力、震颤、尿频、痛经、性功能下降及皮肤潮红等，偶见皮肤过敏反应、低血糖等。

【用法与用量】口服：①用于抑郁症，成人一次 20 mg，一日 1 次，如必要 3 ~ 4 周加量，最大量不超过一日 60 mg。②用于神经性贪食症，成人一次 60 mg，一日 1 次。老年人减量或减少给药次数。③用于强迫症，一次 20 mg，一日 1 次，如疗效欠佳，2 周后逐渐加至最大量 60 mg。

【制剂与规格】氟西汀片：10 mg。

氟西汀胶囊：20 mg。

帕罗西汀 [保（乙）]

Paroxetine

【适应证】抑郁症、强迫症、惊恐障

碍及社交恐怖／社交焦虑障碍等。

【注意事项】【禁忌证】见 SSRIs。

【不良反应】(1) 常见乏力、便秘、腹泻、头晕、多汗、失眠、性功能减退、震颤、尿频、呕吐等。(2) 少见焦虑、食欲改变、心悸、感觉异常、味觉改变、体重变化、肌痛、肌无力、直立性低血压等；罕见锥体外系反应、瞳孔扩大和精神运动性兴奋。此外，锥体外系反应（包括口面肌障碍）和戒断综合征比其他 SSRIs 常见。

【用法与用量】口服：①用于抑郁症、社交恐怖／社交焦虑障碍，成人一次 20 mg，一日 1 次，早上服用，根据临床反应增减剂量，一次增减 10 mg，间隔不得少于 1 周，最大量一日 50 mg。老年人或肝肾功能不全者，可从一日 10 mg 开始，一日最高剂量不得超过 40 mg。②用于强迫症，初始剂量一次 20 mg，一日 1 次，早上服用，每周增加 10 mg，一般剂量为一日 40 mg，一日最高剂量不得超过 60 mg。③用于惊恐障碍，初始剂量一次 10 mg，一日 1 次，早上服用，每周增加 10 mg，一般剂量为一日 40 mg，一日最高剂量不得超过 50 mg。

【制剂与规格】盐酸帕罗西汀片：20 mg。

舍曲林 [保(乙)]

Sertraline

【适应证】(1) 治疗抑郁症的相关症状，包括伴随焦虑、有或无躁狂史的抑郁症。疗效满意后，继续服用可有效防止抑郁症的复发和再发。(2) 治疗强迫症。疗效满意后，继续服用可有效防止强迫症初始症状的复发。

【注意事项】【禁忌证】见 SSRIs。

【不良反应】(1) 常见恶心、腹泻、便秘、厌食、消化不良、心悸、震颤、头晕、失眠、困倦、多汗、口干、性功能障碍。(2) 偶见癫痫发作。(3) 少见 ALT 及 AST 升高、低钠血症、高血压、低血压、心动过速、心电图异常、体重改变、静坐不能、痛经、闭经等；偶见凝血障碍、水肿、精神运动性兴奋、溢乳、男性乳房增大、呼吸困难、阴茎异常勃起、皮疹、脱发、光过敏反应。

【用法与用量】口服：成人初始剂量一次 50 mg，一日 1 次，疗效不佳而对药物耐受性较好的患者可增加剂量，调整剂量的时间间隔不应短于 1 周，最大剂量为一日 200 mg。

【制剂与规格】盐酸舍曲林片：50 mg。

氟伏沙明 [保(乙)]

Fluvoxamine

【适应证】抑郁症、强迫症及相关症状的治疗。

【注意事项】【禁忌证】见 SSRIs。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、口干、腹泻、便秘、消化不良、头痛、困倦、震颤、失眠、眩晕、焦虑。(2) 偶见 5-HT 综合征、凝血功能障碍、锥体外系反应、抗利尿激素分泌异常、溢乳、闭经、脱发、肌无力等。(3) 少见直立性低血压、心电图改变、ALT 及 AST 升高、性功能障碍。

【用法与用量】口服：①用于抑郁症，成人一日 50 ~ 100 mg，一日 1 ~ 2 次，早晨或晚上服用，最大量一日 300 mg。长期用药者应根据疗效调整剂量，并维持在最低有效剂量。老年人及肝肾功能不全者应适当减少剂量。②用于强迫症，成人起始剂量为一日 50 mg，通常有效剂量为一日 100 ~ 300 mg，一日最大剂量为 300 mg。

【制剂与规格】马来酸氟伏沙明片：①50 mg；② 100 mg。

西酞普兰 [保(乙)]

Citalopram

【适应证】用于抑郁性精神障碍。

【注意事项】【禁忌证】见 SSRIs。

【不良反应】(1) 常见恶心、多汗、口干、头痛、失眠等。(2) 少见癫痫发作、过敏反应。

【用法与用量】口服：一次 20 mg，一日 1 次，早晚服用，通常有效剂量为一日 20 ~ 40 mg，最大量为一日 60 mg。长期用药者应根据疗效调整剂量，并维持在最低有效治疗剂量。老年人及肝肾功能不全者应适当减少剂量，最大量为一日 40 mg。肝功能不全者一日剂量不超过

30 mg。

【制剂与规格】氢溴酸西酞普兰片：①10mg；② 20 mg；③ 40 mg。

艾司西酞普兰[保(乙)]

Escitalopram

【适应证】用于抑郁症、广泛性焦虑障碍。

【注意事项】【禁忌证】见SSRIs。

【不良反应】(1) 常见失眠、阳萎、恶心、便秘、多汗、口干、疲劳、嗜睡。(2) 少见头痛、上呼吸道感染、背痛、咽炎和焦虑等；偶见躁狂或轻度躁狂或低钠血症。

【用法与用量】口服：用于抑郁症及广泛性焦虑，起始剂量一次 10 mg，一日 1 次，1 周后可以增至一次 20 mg，一日 1 次，早晚服用。一般情况下应持续几个月，甚至更长时间的治疗。老年患者或肝功能不全者建议一日 10 mg，轻度或中度肾功能不全者无需调节剂量。

【制剂与规格】草酸艾司西酞普兰片：10 mg。

1.13.2 四环类抗抑郁药

马普替林[保(乙)]

Maprotiline

【适应证】用于抑郁症。

【注意事项】(1) 以下情况慎用：①心功能不全、肝肾功能不全、青光眼、前列腺增生者；②高血压患者正在服用肾上腺素受体拮抗药、甲状腺功能亢进者或同时服用甲状腺激素制剂者；③有自杀倾向及有心肌梗死病史者；④孕妇及哺乳期妇女。(2) 老年人用药剂量宜小。(3) 因本品可影响反应能力和警觉性，故在驾车或操纵机械时应小心。(4) 用药期间尤其在治疗的最初数月，应密切观察患者有无发热、咽痛及白细胞计数变化。

【禁忌证】对马普替林及其赋形剂过敏者、急性心肌梗死或心脏传导阻滞、癫痫或有惊厥病史、闭角型青光眼、尿潴留、合并使用单胺氧化酶抑制药者禁用。

【不良反应】本品的不良反应与三环类相似，但少而轻。(1) 不良反应中以胆碱能阻断症状，常见口干、便秘、视物模糊等。(2) 少见直立性低血压、心动过速、癫痫发作、震颤、焦虑、躁狂、ALT 及 AST 升高、尿潴留、过敏反应、中性粒细胞计数减少。

【用法与用量】口服：成人开始一日 25 ~ 75 mg，分 2 ~ 3 次给药，2 周以后根据需要一日增加 25 mg。有效治疗量一日不宜超过 150 mg。老年人开始一次 10 mg，一日 3 次，或一次 75 mg，一日 1 次。根据需要一日增加 25 mg，有效治疗量一日不宜超过 75 mg。

【制剂与规格】马普替林片：① 10mg；② 25 mg；③ 50 mg；④ 75 mg。

米安色林[保(乙)]

Mianserin

【适应证】用于各型抑郁症。

【注意事项】(1) 在服药最初几日内，可能影响精神运动性功能。(2) 对双相抑郁症患者可能诱发轻躁狂发作。如出现应停止治疗。(3) 可能引起骨髓抑制，主要为粒细胞减少症和粒细胞缺乏症。一般见于治疗 4 ~ 6 周，停药后即可恢复。(4) 当患者同时有糖尿病、心脏病、肝或肾功能不全时，应采取常规预防措施，并严密检查其同时服用的其他药物剂量；用于闭角型青光眼或前列腺肥大患者，应加强观察。(5) 老年患者用药，开始不超过一日 30 mg，应在密切观察下逐步增加剂量。

【禁忌证】躁狂症患者禁用。

【不良反应】(1) 偶见造血功能障碍、癫痫发作、轻度躁狂、低血压、肝功能损害、关节痛、水肿及男子女性型乳房。治疗开始时可出现嗜睡，但为了保证最有效的抗抑郁作用，不应减低盐酸米安色林的剂量。(2) 与抑郁症有关的一些症状，如视物模糊、口干、便秘等在盐酸米安色林治疗期间并不增加其发生率和严重程度。

【用法与用量】口服：成人开始一日 30 mg，根据临床效果逐步调整剂量。有效剂量为一日 30 ~ 90 mg（一般为一日 60 mg）。(1) 每日量可分次服用，但最好能于睡前顿服（夜间一次服用能改善睡眠）。(2) 临床症状改善后，仍应维持几个月的药物治疗。

【制剂与规格】盐酸米安色林片：60 mg。

1.13.3 三环类抗抑郁药

阿米替林 [基(基)、保(甲)]

Amitriptyline

【适应证】用于焦虑症，也用于内源性、迟发性、精神性、耗竭性、反应性和神经性及激越性抑郁症。

【注意事项】(1) 本品可透过胎盘屏障，妊娠期妇女慎用。(2) 阿米替林可由乳汁分泌，哺乳期妇女慎用。(3) 癫痫患者或有癫痫发作倾向者、甲状腺功能亢进、精神分裂症、前列腺炎、膀胱炎患者、支气管哮喘患者慎用或禁用。(4) 5 岁以下儿童慎用。(5) 老年人对本品的代谢及排泄功能下降，对本品的敏感性增强，用药时应酌减剂量，需格外注意防止直立性低血压的发生。(6) 用药前后及用药时应监测白细胞计数、肝功能及心电图等。(7) 过量时可引起兴奋、口干、瞳孔扩大、心动过速、尿潴留、肠梗阻等抗胆碱作用的症状。严重时可致意识障碍、惊厥、肌阵挛、反射亢进、低血压、代谢性酸中毒、呼吸心跳抑制等。即使恢复后仍有可能发生致命的心律失常以及谵妄、意识障碍、激惹和幻觉等。

【禁忌证】对本品过敏者、严重心脏病、高血压、肝肾功能不全、青光眼、排尿困难、尿潴留以及同时服用单胺氧化酶抑制药患者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、心动过速、震颤、多汗、视物模糊、口干、便秘、排尿困难、直立性低血压、心电图异常、困倦、头痛、体重增加、性功能障碍；偶见谵妄、心脏传导阻滞、心律失常、粒细胞缺乏、猝死等；少见激越、失眠、精神症状加重、青光眼加剧、麻痹性肠梗阻、尿潴留、抽搐、迟发性运动障碍、男性乳房增大、闭经、肝功能异常、胆汁淤积性黄疸、过敏反应等。

【用法与用量】口服：成人常用量开始一日 75 mg，分 2 ~ 3 次服用，然后根据病情和耐受情况逐渐增至一日 150 ~ 250 mg。最高不超过一日 300 mg。老年人、儿童应减量使用。

【制剂与规格】盐酸阿米替林片：25 mg。

丙米嗪 [保(甲)]

Imipramine

【适应证】用于各种类型的抑郁症，但对精神分裂症伴发的抑郁状态几乎无效或疗效差，也用于小儿遗尿症。

【注意事项】(1) 对其他三环类抗抑郁药过敏者，也可对本药过敏。(2) 对有癫痫发作倾向者、精神分裂症患者、严重抑郁症患者、前列腺炎、膀胱炎患者慎用。(3) 儿童对本药较敏感。(4) 老年人代谢和排泄下降，对本药的敏感性增强，服药后产生不良反应（如头晕、排尿困难等）的危险性增大，用药时尤应防止出现直立性低血压。(5) 本品可分泌进入乳汁，哺乳期妇女在使用期间应停止哺乳。(6) 用药前后及用药时应当监测血细胞计数、血压、心肝肾功能。(7) 停用单胺氧化酶抑制药 2 周后才能使用本药，禁止两者合用。(8) 宜在餐后服药，以减少胃部刺激。对易发生头晕等不良反应者，可在晚间顿服，以免影响白天工作。(9) 开始用药时常先出现镇静作用，抗抑郁的疗效需在 2 ~ 3 周之后才出现。(10) 骤然停药可产生头痛、恶心等反应，宜在 1 ~ 2 个月逐渐减量停药。停药后，本药的作用至少可持续 7 日，故停药期间仍应继续观察服药期间内的所有反应。

【禁忌证】对三环类抗抑郁药过敏者、癫痫、谵妄患者、粒细胞减少者、高血压、严重心脏病、青光眼、甲状腺功能亢进、排尿困难、尿潴留、支气管哮喘、肝肾功能不全者、妊娠期妇女 6 岁以下儿童禁用。

【不良反应】(1) 偶见骨髓抑制、白细胞减少，严重时可见异常出血、巩膜或皮肤黄染等。(2) 心动过速、心肌损害、直立性低血压。(3) 便秘、口干、腹泻、恶心、呕吐、食欲减退、麻痹性肠梗阻。偶见中毒性肝损害。(4) 焦虑、精神紊乱、震颤、视物模糊、眩晕、失眠、嗜睡、疲劳、虚弱及激动不安。严重者可有惊厥、意识障碍、手足麻木。偶见癫痫发作。(5) 尿潴留、性功能减退、乳房肿痛（包括男性）。

(6) 可能发生变态反应。还可导致机体的光敏感性增加。(7) 体重增加、体液潴留、脱发、皮疹、多汗、发声或吞咽困难、运动障碍等。

【用法与用量】口服：(1) 成人初始剂量为一次 25 ~ 50 mg，一日 2 次，早上与中午服。以后逐渐增至一日 100 ~ 250 mg，维持量为一日 50 ~ 150 mg。一日极量为 300 mg。老年人剂量应从小剂量开始，视病情酌减用量。(2) 儿童，用于小儿遗尿症，6 岁以上儿童一日 25 ~ 50 mg，睡前 1 小时顿服。

【制剂与规格】盐酸丙米嗪片：25 mg。

氯米帕明 [保 (甲／乙)]

Clomipramine

【适应证】用于抑郁症、强迫症、恐怖症。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如支气管哮喘、心血管疾病、癫痫、青光眼、肝功能异常、甲状腺功能亢进、前列腺肥大、精神分裂症、尿潴留患者慎用；有自杀倾向者、卟啉代谢障碍患者、孕妇及哺乳期妇女。(2) 儿童对本品较敏感，宜从小剂量开始，逐渐加大至最适剂量。(3) 老年人对本品敏感性增强，用量应减小。(4) 用药前后及治疗期应监测血细胞计数、血压、心电图、肝功能等。(5) 突然停药时可产生头痛、恶心等不适，宜在 1 ~ 2 个月期间逐渐减少用量。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者、苯二氮䓬类药、三环抗抑郁药过敏者。(2) 同时服用单胺氧化酶抑制药治疗者。(3) 心肌梗死急性发作期者。

【不良反应】常见便秘、口干、体重变化、性功能障碍等；严重不良反应可见粒细胞缺乏、心搏骤停、震颤谵妄、癫痫发作、5-HT 综合征等；少见白细胞与血小板计数减少、贫血、躁狂、冲动、溢乳、分泌抗利尿激素、尿潴留、色素沉着、过敏反应等。

【用法与用量】口服：①成人，一次 25 mg，一日 2 ~ 3 次，然后根据需要和耐受情况调整用量。一日不超过 150 mg。②老年人，开始一日 10 mg，根据耐受情况调整用药剂量，一日不超过 30 ~ 50 mg 为宜。③儿童，开始一日 10 mg，10 日后 5 ~ 7 岁者增至 20 mg，8 ~ 14 岁增至 20 ~ 25 mg，14 岁增至 50 mg，分次服用。

【制剂与规格】盐酸氯米帕明片：25 mg。

多塞平 [基 (基)，保 (甲／乙)]

Doxepin

【适应证】用于抑郁症及焦虑性神经症。

【注意事项】【不良反应】见盐酸氯米帕明。

【禁忌证】严重心脏病、近期有心肌梗死发作史、癫痫、青光眼、尿潴留、甲状腺功能亢进、肝功能损害、谵妄、粒细胞减少、对三环类药物过敏者。

【用法与用量】口服：开始一次 25 mg，一日 2 ~ 3 次，根据病情逐渐增加至一日 150 ~ 300 mg。

【制剂与规格】盐酸多塞平片：25 mg。

1.13.4 单胺氧化酶抑制药

吗氯贝胺 [保 (乙)]

Moclobemide

【适应证】用于抑郁症。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如肝肾功能不全者、妊娠及哺乳期妇女、癫痫患者、甲状腺功能亢进者、驾车司机或机械操作者。(2) 老年人剂量应酌减。(3) 用药期间不宜进食富含酪胺的食品（如奶酪、红葡萄酒、酵母和大豆发酵制品）。(4) 服用其他抗抑郁药者，需停用 2 周以上才可应用本品；用药过量时需对症支持治疗。

【禁忌证】对本品过敏、有意识障碍者、嗜铬细胞瘤患者、儿童及正在服用单胺氧化酶抑制药者。

【不良反应】常见头晕、头痛、恶心、多汗、口干、失眠、困倦、心悸等；少见震颤、AST 及 ALT 升高、意识模糊（可逆性）。

【用法与用量】口服：起始量一日 100 ~ 300 mg，一日 2 ~ 3 次，常用量一

日300～450 mg。疗效不佳者可增加剂量，最大量不超过一日600 mg。老年人、肝肾功能不全者应减量。

【制剂与规格】吗氯贝胺片：150 mg。

1.13.5 其他抗抑郁药

文拉法辛[保(乙)]

Venlafaxine

【适应证】用于各种类型抑郁障碍、广泛性焦虑障碍。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如肝肾功能不全者、近期心肌梗死、不稳定型心绞痛、血液病、癫痫、躁狂、青光眼、有出血倾向者慎用；司机和机械操纵者、儿童、孕期及哺乳期妇女。(2) 用药前、后及用药期间应定期测量血压。(3) 用药过量时给予对症支持治疗。

【禁忌证】对文拉法辛及其赋形剂过敏者及和在服单胺氧化酶抑制药的患者。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、口干、畏食、腹泻、便秘、消化不良、嗜睡、失眠、头痛、头晕、紧张、焦虑、出汗、打哈欠、性功能障碍等。(2) 严重不良反应有粒细胞缺乏、紫癜。(3) 少见无力、震颤、激越、腹泻、腹胀、鼻炎、心悸、高血压、躁狂、惊厥、体重下降、ALT及AST升高、视物模糊等。(4) 偶见抗利尿激素分泌异常、皮疹和瘙痒等。

【用法与用量】口服：起始推荐剂量为一日75 mg，分2～3次服用（缓释制剂一日1次），必要时一日可增加至225 mg。

【制剂与规格】盐酸文拉法辛缓释片：① 37.5 mg；② 75 mg。

盐酸文拉法辛缓释胶囊：① 75 mg；② 150 mg。

盐酸文拉法辛胶囊：25 mg。

文拉法辛片：① 37.5 mg；② 25 mg。

曲唑酮[保(乙)]

Trazodone

【适应证】用于抑郁症。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者、孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 本品可引起警觉性下降、困倦等，司机或机械操作者慎用。(3) 老年人用药剂量应减少。

【禁忌证】对曲唑酮及其赋形剂过敏者、严重的心脏病或心律失常者、意识障碍者。

【不良反应】(1) 常见困倦、疲乏、眩晕、头痛、失眠、紧张、震颤、激动、视物模糊、口干、便秘。(2) 严重不良反应有意识错乱或谵妄（尤其是老年人）。(3) 少见直立性低血压、心动过速、恶心、呕吐、腹部不适。罕见肌肉疼痛、多梦、ALT及AST升高、皮疹等。

【用法与用量】口服：起始剂量一日50～100 mg，常用量一日100～150 mg，最大剂量一日不超过400 mg，一日2次。老年人及肝肾功能不全者应酌减剂量。在产生足够疗效后，可逐步降至最小有效量，维持数月。

【制剂与规格】盐酸曲唑酮片：50 mg。

米氮平[保(乙)]

Mirtazapine

【适应证】用于抑郁症。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女避免使用。(2) 以下情况慎用，如儿童、严重肝肾功能不全、心血管疾病、癫痫、器质性脑综合征、糖尿病、黄疸、排尿困难、青光眼等患者；本品可引起警觉性下降、困倦等，司机或机械操作者慎用。(3) 老年人增加剂量应在医师的密切观察下进行。

【禁忌证】对本品及本品任何成分过敏及正在服用单胺氧化酶抑制药的患者禁用。

【不良反应】(1) 常见食欲增加、体重增加、困倦、镇静、头晕。(2) 严重不良反应有急性骨髓抑制。(3) 少见直立性低血压、震颤、肌痉挛、ALT及AST升高、皮疹等。

【用法与用量】口服：成人起始剂量为一次15 mg或30 mg，一日1次（最好睡前顿服），逐渐加大剂量至最佳疗效，有效剂量通常为一日15～45 mg。肝肾功能不全者应减量。

【制剂与规格】米氮平片：① 15 mg；② 30 mg；③ 45 mg。

度洛西汀[保(乙)]

Duloxetine

【适应证】用于抑郁症。

【注意事项】(1) 肝功能不全患者使用本品后血药浓度会明显增加，因此不推荐此类患者服用度洛西汀。(2) 严重肾功能不全（肌酐清除率 < 30 ml/min）者使用度洛西汀其血浆浓度会增加，尤其是其代谢物。因此，不推荐终末期肾病患者使用本品。(3) 孕妇及哺乳期妇女不推荐使用。(4) 既往有癫痫发作史者、已稳定的闭角型青光眼者慎用。(5) 对部分老年人应酌减剂量；儿童慎用。(6) 治疗开始前、后应监测血压。(7) 停药后应注意观察患者有无停药后的症状出现（如头晕、恶心、头痛、感觉异常、呕吐、易怒、噩梦等），建议逐渐减药而不是骤停药物。

【禁忌证】对本品过敏与正在服用单胺氧化酶抑制药者禁用；未经治疗的闭角型青光眼患者应避免使用。

【不良反应】常见恶心、嗜睡、眩晕、便秘、口干、出汗、食欲减退和疲劳等。

【用法与用量】口服：推荐起始剂量一次 20 ~ 30 mg，一日 2 次，临床研究尚未证实剂量超过一日 60 mg 可增加疗效。

【制剂与规格】盐酸度洛西汀肠溶胶囊：① 30 mg；② 60 mg。

瑞波西汀[保(乙)]

Reboxetine

【适应证】成人抑郁症。

【注意事项】(1) 本品停用 7 日以内不得使用 MAOI；对停用 MAOI 不超过 2 周者，亦不宜使用本品。(2) 服用本品后不会立即减轻症状，通常症状的改善会在服药后几周内出现，因此，即使服药后没有立即出现病情好转也不应停药，直到服药几个月后医师建议停药为止。(3) 但如遗漏一次服药，可在下一个用药时间继续服用下一个剂量即可。(4) 老年患者对本品有较大的个体差异，体内含量增加，剂量不易掌握，目前暂不推荐用于老年人；儿童不宜使用。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女、对本品过敏者、肝肾功能不全者、有惊厥史者、癫痫、青光眼、前列腺增生引起的排尿困难、血压过低、心脏病患者如近期发生心血管意外事件的患者禁用。

【不良反应】可见口干、便秘、多汗、失眠、阴茎勃起困难、排尿困难、尿潴留、心率加快、静坐不能、眩晕或直立性低血压。

【用法与用量】口服：一次 4 mg，一日 2 次，用药后 2 ~ 3 周逐渐起效，用药 3 ~ 4 周后视需要可增至一日 12 mg，分 3 次服用，一日最大剂量不得超过 12 mg。

【制剂与规格】甲磺酸瑞波西汀片：4 mg。

噻萘普汀[保(乙)]

Tianeptine

【适应证】用于抑郁症、焦虑症。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如心血管疾病、严重肝肾功能不全者、胃肠道疾病、司机或机械操作者。(2) 老年人应减量服用。(3) 需要全身麻醉者，在手术前 24 或 48 小时停服本品。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肝肾功能不全者、正在服用单胺氧化酶抑制药者、妊娠及哺乳期妇女、15 岁以下儿童。

【不良反应】常见困倦、眩晕、头痛、失眠、梦魇、体重增加、口干、便秘。少见直立性低血压、心悸、心率减慢、震颤、焦虑、激惹、潮热、面部潮红、口苦、胃肠胀气、腹部疼痛、ALT 及 AST 升高、皮疹；较严重不良反应有室性心律失常。

【用法与用量】口服：一次 12.5 mg，一日 3 次，餐前服用。年龄超过 70 岁和肾功能不全者，一日最高剂量为 25 mg。

【制剂与规格】噻萘普汀片：12.5 mg。

贯叶连翘提取物

Hypericum Perforatum Extract

【适应证】用于抑郁症、焦虑或烦躁不安。

【注意事项】(1) 严重肝肾功能不全者及老年人应慎用或减量。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 本品有抑制 MAO 的作用，饮食方面应限制乳酪制品等的摄入；有光敏性皮肤的患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、光敏性皮肤者、12 岁以下儿童。

【不良反应】常见肠道反应、头晕、疲劳、镇静、过敏反应(如皮肤红肿、瘙痒)。

【用法与用量】口服：成人和 12 岁以上儿童，一次 300 mg，一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】贯叶连翘提取物片剂：每片含贯叶连翘干燥提取物 300 mg（其中贯叶金丝桃素含量不少于 0.9 mg，总金丝桃素含量不少于 0.4 mg)。

1.14 焦虑障碍及其药物治疗

焦虑（anxiety）是一种担心发生威胁自身安全和其他不良后果的心境状态。患者在缺乏明显客观因素或充分根据的情况下，对其本身健康或其他问题感到忧虑不安，或认为病情严重，或认为问题复杂，无法解决等，以致坐立不安、惶惶不可终日，即使多方劝解也不能消除。有时常伴有自主神经功能紊乱和疑病观念，常在焦虑性神经症表现突出。

焦虑障碍的治疗包括心理治疗和药物治疗。心理治疗可采取支持性心理治疗(倾听、理解、解释、宣泄、保证等）使患者对疾病本身有正确的认识，消除患者对疾病本身的错误认识和疑虑，增强其配合治疗和自我战胜疾病的信心并付之行动。

对于急性发作或严重的病例应予以药物治疗。常用药物有抗焦虑药、抗抑郁药甚至某些抗精神病药。苯二氮䓬类药短期使用可缓解严重的焦虑，但应避免长期使用，以防产生依赖性。持续性焦虑和躯体症状，则以血浆半衰期较长的药物为宜，如地西泮、氯氮䓬、阿普唑仑。如患者焦虑呈波动形式，应选择短半衰期的药物，如奥沙西泮、劳拉西泮等。

阿普唑仑[保(甲)]

Alprazolam

【适应证】用于抗焦虑、紧张、激动、惊恐，也可用于催眠、抗抑郁及抗惊厥的辅助用药。

【注意事项】(1) 精神抑郁者用本品时可出现躁狂或轻度躁狂。(2) 停药和减药需逐渐进行。(3) 在治疗恐惧症过程中发生晨起焦虑症状，表示有耐受性或两次间隔期的血药浓度不够，可考虑增加服药次数。(4) 长期应用本品有明显的依赖性，应特别注意。

【禁忌证】对本品及其他苯二氮䓬类药过敏者、青光眼者、睡眠呼吸暂停综合征患者、严重呼吸功能不全者、严重肝功能不全者，妊娠期妇女及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】见地西泮。

【用法与用量】口服：①成人常用量。抗焦虑，开始一次 0.4 mg，一日 3 次，用量按需递增。最大限量一日可达 4 mg。镇静催眠，0.4 ~ 0.8 mg，睡前服。老年和体弱患者开始用小量，一次 0.2 mg，一日 3 次，逐渐递增至最大耐受量。抗恐惧，0.4 mg，一日 3 次，需要时逐渐增加剂量，一日最大量可达 10 mg。②儿童常用量。18 岁以下，用量尚未确定。

【制剂与规格】阿普唑仑片：0.4 mg。

劳拉西泮[保(乙)]

Lorazepam

【适应证】(1) 抗焦虑，包括伴有精神抑郁的焦虑。(2) 镇静催眠。(3) 缓解由于激动诱导的自主症状，如头痛、心悸、胃肠不适、失眠等。

【注意事项】(1) 本品不推荐用于原发性抑郁障碍的精神病患者。(2) 服用本品者不能驾车或操纵精密机器。(3) 服用本品对乙醇及其他中枢神经抑制药的耐受性降低。(4) 连续服用的患者突然停药，会出现戒断综合征（抽搐、震颤、腹部和肌肉痉挛、呕吐、多汗)，故应先减量后再逐渐停药。(5) 有药物或乙醇依赖倾向的患者服用本品时应严密监测，防止产生依赖性。(6) 对体弱的患者应酌情减少用量。(7) 肝功能不全者偶可引起本品清除半衰期的延长。

【禁忌证】对苯二氮䓬类药物过敏者、青光眼患者、重症肌无力者禁用。

【不良反应】(1) 常见镇静、眩晕、乏力，步态不稳。(2) 少见头痛、恶心、激越、皮肤症状，一过性遗忘。一般发生在治疗之初，随着治疗的继续而逐渐减轻或消失。(3) 静脉注射可发生静脉炎或形成静脉血栓。

【用法与用量】(1) 口服：用于抗焦虑，成人一次 1 ~ 2 mg，一日 2 ~ 3 次；用于镇静催眠，睡前服 2 mg。年老体弱者应减量。12 岁以下儿童安全性与剂量尚未确定。(2) 肌内注射：抗焦虑、镇静催眠，按体重 0.05 mg/kg，总量不超过 4 mg。(3) 静脉注射：用于癌症化疗止吐，在化疗前 30 分钟注射 2 ~ 4 mg，与奋乃静合用效果更佳，必要时重复给药；癫痫持续状态，按体重 0.05 mg/kg，一次不超过 4 mg，如 10 ~ 15 分钟后发作仍继续或再发，可重复注射 0.05 mg/kg，如再经 10 ~ 15 分钟仍无效，需采用其他措施，12 小时内用量一般不超过 8 mg。

【制剂与规格】劳拉西泮片：① 0.5 mg；② 1 mg；③ 2 mg。

劳拉西泮注射液：①1 ml：2 mg；②1ml：4 mg。

奥沙西泮 [保（乙）]

Oxazepam

【适应证】用于短期缓解焦虑、紧张、激动，也可用于催眠，焦虑伴有精神抑郁的辅助用药，并能缓解急性乙醇戒断症状。

【注意事项】(1) 对本品及苯二氮䓬药过敏者。(2) 肝肾功能不全者，本品的血浆消除半衰期延长。(3) 本品可通过胎盘屏障及由乳汁分泌。(4) 以下情况慎用：①严重急性乙醇中毒，可加重中枢神经系统抑制作用。②重症肌无力，病情可能被加重。③急性或隐性闭角型青光眼可因本品的抗胆碱能效应而使病情加重。④低蛋白血症时，可致易嗜睡难醒。⑤多动症者可有反常反应。⑥严重慢性阻塞性肺部病变，可加重呼吸衰竭。⑦外科或长期卧床病人，咳嗽反射可收到抑制。⑧有药物滥用和依赖史者。(5) 幼儿中枢神经系统对本品异常敏感。(6) 老年人中枢神经系统对本品较敏感。(7) 癫痫患者突然停药可引起癫痫持续状态。(8) 严重的精神抑郁可使病情加重，甚至产生自杀倾向，应采取预防措施。(9) 避免长期大量使用而依赖，如长期使用应逐渐减量，不宜骤停。(10)对本类药耐受量小的患者初用量宜小。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女、新生儿及 6 岁以下儿童禁用。

【不良反应】见地西泮。

【用法与用量】口服：①用于抗焦虑，成人一次 15 ~ 30 mg，一日 3 ~ 4 次。②用于镇静催眠、急性乙醇戒断症状，一次 15 ~ 30 mg，一日 3 ~ 4 次。③用于一般性失眠，15 mg，睡前服。④老年或体弱患者抗焦虑时，开始用小量，一次 7.5 mg，一日 3 次，按需增至 15 mg，一日 3 ~ 4 次。⑤儿童常用量，6 ~ 12 岁量尚未有具体规定。

【制剂与规格】奥沙西泮片：15 mg。

氯硝西泮 [保（乙）]

Clonazepam

【适应证】用于各种类型的癫痫。

【注意事项】【不良反应】见地西泮。

【禁忌证】急性闭角型青光眼、过敏严重、肝脏疾病。

【用法与用量】口服：①成人，应从小剂量开始，每次 0.5 mg，一日 2 ~ 3 次，根据病情逐渐增加剂量，最大剂量不超过一日 20 mg。②儿童，10 岁或体重 < 30 kg，开始一日 0.01 ~ 0.03 mg/kg，分 2 ~ 3 次服用；以后每 3 日增加 0.25 ~ 0.5 mg/kg，至达到 0.1 ~ 0.3 mg/kg，疗程 3 ~ 6 个月。

【制剂与规格】氯硝西泮片：2 mg。

丁螺环酮 [保（乙）]

Buspirone

【适应证】用于各种焦虑症。

【注意事项】(1) 老人、肝、肾功能不全者剂量应减少。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 与苯二氮䓬类药无交叉耐受性，换用本品时不能减轻苯二氮䓬类戒断症状。应告之患者本品显效较慢，需 2 ~ 4 周，不应自行加量或停药。

【禁忌证】对本品过敏者，癫痫患者，重症肌无力患者，急性闭角型青光眼患者及儿童禁用。

【不良反应】(1) 常见恶心、乏力、烦躁不安。(2) 少见失眠、兴奋、头痛、头晕、震颤、共济失调、麻木、疲乏、感觉异常、胃肠不适。(3) 大剂量时能升高催乳素、生长激素浓度。(4) 可能诱发轻躁狂或躁狂。(5) 有轻度抗抑郁作用，大

剂量可出现心境恶劣。

【用法与用量】口服：开始时一次5 mg，一日2～3次。以后根据病情和耐受情况调整剂量，每隔2～3日增加5 mg至一日20～40 mg。

【制剂与规格】盐酸丁螺环酮片：5 mg。

坦度螺酮[保（乙）]

Tandospirone Citrate

【适应证】(1) 各种神经症所致的焦虑状态，如广泛性焦虑障碍。(2) 原发性高血压、消化性溃疡等躯体疾病伴发的焦虑状态。

【注意事项】(1) 器质性脑功能障碍者慎用（可能增强本品的作用）。中度或严重呼吸功能衰竭者慎用（有可能使症状恶化）。心功能不全者慎用（有可能使症状恶化）。肝肾功能不全者慎用（有可能影响药动学）。(2) 老年人从小剂量开始。(3) 可能对催乳素、促性腺激素或睾酮有兴奋作用。(4) 对病程较长（3年以上），病情严重或其他药物（苯二氮䓬类药）无效的难治性焦虑患者，本品也难以产生疗效。当一日用药剂量达60 mg仍未见明显疗效时，应及时与医生联系，本品不得随意长期应用。(5) 本品可引起嗜睡、眩晕等，故服用本品过程中不得从事有危险的机械性作业。(6) 本品与苯二氮䓬类药无交叉依赖性，若立即将苯二氮䓬类药更换为本品时，可能出现苯二氮䓬类药的戒断现象，加重精神症状，故在需要停用苯二氮䓬类药时，需缓慢减量。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见头痛、头晕、嗜睡、心动过速、口干、出汗、乏力和食欲缺乏。

【用法与用量】口服：常用量一次10 mg，一日3次。根据病情适当增减剂量，最大剂量一日60 mg。

【制剂与规格】枸橼酸坦度螺酮片：10 mg。

谷维素[保（乙）]

Oryzanol

【适应证】用于神经官能症、经前期紧张综合征、更年期综合征的镇静助眠。

【注意事项】胃及十二指肠溃疡患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见胃部不适、恶心、呕吐、口干、疲乏、皮疹、乳房肿胀、油脂分泌过多、脱发、体重增加等不良反应。停药后均可消失。

【用法与用量】口服：成人一次10～30 mg，一日3次。

【制剂与规格】谷维素片：10 mg。

1.15 双相情感障碍及其药物治疗

双相情感障碍（bipolar affective disorder）一般呈发作性病程，躁狂和抑郁常反复循环或交替出现，也可以混合方式存在，病情严重者在发作高峰期还可出现幻觉、妄想或紧张等精神病性症状，长期反复发作可导致患者人格改变和社会功能受损。

抗躁狂药目前多被称为心境稳定药。因其不仅具有抗躁狂作用，对于躁狂或抑郁发作均有治疗和预防复发作用，且不会引起躁狂与抑郁转相，或导致发作变频繁转为快速循环或混合状态。目前，比较公认的具有心境稳定剂作用的抗躁狂药如碳酸锂、非典型抗精神病药及抗癫痫药丙戊酸盐、卡马西平。此外，抗精神病药常用于躁狂发作的急性期治疗。

丙戊酸钠 起始剂量一次250 mg，一日2次，第3日500 mg，一日2次，第一周末750 mg，一日2次。最大一日剂量不超过3 000 mg，推荐治疗血浓度50～125 μg/ml。

卡马西平 一日400～1 600 mg，通常剂量为一日400～600 mg，分2～3次服用。对急性躁狂症，剂量应适当地迅速递增。用于预防双相障碍，应以小剂量逐渐增加剂量，以确保得到最佳耐受性。治疗躁狂血浆浓度和癫痫相似为4～12 μg/ml。预防治疗的血浆浓度为6 μg/ml。（其他见1.8.1）

碳酸锂[保(甲/乙)]

Lithium Carbonate

【适应证】主要治疗躁狂症，对躁狂和抑郁交替发作的双相情感性精神障碍有很好的治疗和预防复发作用，对反复发作的抑郁症也有预防发作作用。也用于治疗分裂-情感性精神病。

【注意事项】(1) 妊娠初期3个月禁用，哺乳期妇女使用本品期间应停止哺乳。(2) 脑器质性疾病、严重躯体疾病和低钠血症患者慎用。(3) 12岁以上儿童从小剂量开始，根据血锂浓度缓慢增加剂量。(4) 老年人用药，锂在老年人体内排泄慢，易蓄积，按情况酌减用量，小剂量开始，缓慢增加剂量，密切关注不良反应的出现。(5) 碳酸锂中毒量与治疗量很接近，用药期间需要定期监测血锂浓度。(6) 治疗期应1～2周一次，维持期可1个月1次。(7) 取血时间应在次日晨，即末次服药后12小时。(8) 血锂浓度>1.4 mmol/L时可出现中毒症状，早期表现为粗大震颤、恶心、呕吐、腹泻。血锂浓度>2.5 mmol/L时，可出现抽搐、昏迷、心律失常等。血锂浓度达3.5 mmol/L时可致死。(9) 可疑中毒时应立即查血锂并及时处理。(10) 服本品患者需注意防止体液大量丢失，如持续呕吐、腹泻、大量出汗等情况易引起锂中毒。(11) 服本品期间不可用低盐饮食。(12) 长期服药者应定期检查肾功能和甲状腺功能。(13) 碳酸锂片与缓释制剂具有不同的生物利用度，因此在开始治疗时，需要警惕换用不同制剂可能引起的后果。(14) 锂盐应逐步减量停药，突然停药很可能导致病情复发。

【禁忌证】(1) 严重心血管疾病、肾病、脑损伤、电解质平衡失调、使用利尿药者。(2) 妊娠初期3个月妇女。(3) 12岁以下儿童。

【不良反应】(1) 常见口干、烦渴、多饮、多尿、便秘、腹泻、恶心、呕吐、腹痛，双手震颤、精神萎靡、无力、困倦、记忆减退、中性粒细胞升高等。(2) 严重不良反应在中毒时可出现视物模糊、胃肠不适(食欲减退、呕吐、腹泻)、肌无力、中枢神经系统失调（轻度困倦和迟滞发展到共济失调伴眩晕、粗大震颤、协调性差、构音不良），此时需要停止治疗；严重的超剂量用药可致肌腱反射亢进、癫痫、中毒性精神病、晕厥、肾衰竭、循环衰竭、昏迷以及偶发的死亡。(3) 少见白细胞计数升高、体重增加、水肿、甲状腺功能亢进或减退、高钙血症、甲状腺肿、抗利尿激素浓度增加、低钾血症、心电图及肾功能改变。

【用法与用量】口服：用于急性躁狂，一般从小剂量开始，一次0.25 g，一日3次，之后根据患者需要、服药反应及血锂浓度逐日增加0.25～0.5 g，一般一日不超过1.5～2.0 g。维持治疗，一日不超过1.0 g。剂量最好根据血锂浓度调整。服用碳酸锂缓释片，一日0.9～1.5 g，分1～2次服。维持治疗，一日0.6～0.9 g。

【制剂与规格】碳酸锂片：0.25 g。

碳酸锂缓释片：0.3g。

托吡酯[保(乙)]

Topiramate

【适应证】用于癫痫，也用于双相急性躁狂、双相抑郁、双相快速循环、分裂性情感障碍。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见1.8.1。

【用法与用量】口服：开始一日25～50 mg，以后1～2周增加25～50 mg，有效剂量一日200～400 mg。

【制剂与规格】托吡酯片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

1.16 精神病性障碍及其药物治疗

精神病性障碍(psychosis)指临床表现为幻觉、妄想等精神病性症状的一类疾病。精神分裂症、分裂型障碍、妄想性障碍、急而短暂的精神病性障碍、分裂情感性障碍及脑器质性精神障碍等都可以精神病性症状为主或病程中出现精神病性症状。精神病性障碍用药可以控制各种精神病理改变引起的兴奋紊乱，缓解症状，并能预防症状复发。

抗精神病药可分为以下两大类。

(1) 第一代抗精神病药（典型抗精神病药）：①吩噻嗪类，如氯丙嗪、奋乃静、氟奋乃静、三氟拉嗪、硫利达嗪及长效制剂氟奋乃静、棕榈哌泊塞嗪等；②丁酰苯类，如氟哌啶醇及长效制剂癸氟哌啶醇和五氟利多等；③硫杂蒽类，如氯普噻吨、氟哌噻吨；④苯甲酰胺类，如舒必利等。第一代抗精神病药主要为多巴胺 D_2 受体阻断药，其他尚可阻断 α 受体、M_1 受体、H_1 受体等。这些药物对精神分裂症患者的阳性症状相当有效，但有某些不良反应，如急性肌张力障碍、震颤等。其局限性为：①不能改善患者的认知功能；②对精神分裂症阴性症状一般疗效不佳；③部分患者的阳性症状不能有效缓解；④引起锥体外系和迟发性运动障碍等不良反应较多；⑤患者依从性较差。

(2) 第二代抗精神病药（非典型抗精神病药）：除拮抗多巴胺受体外，还具有较强的 5- 羟色胺 2（$5\text{-}HT_2$）受体拮抗作用，因此也称多巴胺 -5- 羟色胺受体拮抗药，它们对中脑边缘系统的作用比对纹状体系统作用更具有选择性，常用药有氯氮平、利培酮、奥氮平、喹硫平、阿立哌唑和齐拉西酮。这类药避免了第一代抗精神病药的某些缺点，对精神分裂症患者的阳性症状和阴性症状均有一定疗效，较少影响认知功能，有利于患者回归社会。缺点主要是：①某些第二代抗精神病药（尤其是氯氮平）的不良反应较多且严重；②部分患者疗效不满意。

抗精神病药的使用原则如下。

①以单一药物治疗为主，包括各种精神病性障碍的急性发作、复发和病情恶化的病例。疗效不满意时，若无严重不良反应，可在治疗剂量范围内适当增加剂量。经足够剂量、适当疗程（6 ~ 8 周）治疗仍无效时，可考虑换用另一类化学结构的抗精神病药。

②经上述治疗，若疗效仍不满意，可考虑两种药物合用，以化学结构不同，作用机制不同的药物联合应用较好，在达到预期疗效后仍以单一用药为原则。

③药物种类、剂量和用法均应个体化，因人而异。

④治疗中应密切观察，正确评价疗效，注意药品不良反应，及时处理并调整剂量。

⑤给药时一般由小剂量开始，逐步增加至有效治疗量。剂量应递减，不宜骤停。药物调整速度和幅度，应根据患者情况和药物性质而定。疗程应充足，急性期治疗至病情缓解后，应有相当时间的巩固治疗，然后减少剂量做较长时间维持治疗，对精神分裂症等病程长的疾病，一般不少于 2 ~ 5 年，以预防疾病复发。

氯丙嗪 [基（基）, 保（甲）]

Chlorpromazine

【适应证】(1) 精神分裂症及其他精神疾病的兴奋躁动、紧张不安、幻觉妄想等症状。(2) 镇吐，但对运动病的呕吐无效，也可用于顽固性呃逆。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女避免服用，哺乳期妇女在服药期间应中断哺乳。(2) 肝肾功能不全、严重心血管疾病、帕金森病、癫痫、抑郁症、重症肌无力、前列腺增生病、闭角型青光眼、严重呼吸系统疾病、既往有黄疸史或血液系统疾病史者慎用。(3) 老年人易出现直立性低血压、体温过高或过低，用量应小，加量应缓慢。(4) 较大剂量使用时可能会发生光敏性皮炎，应注意避免日光直射。(5) 长期用药应监测肝功能。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森及帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、昏迷及对吩噻嗪类药过敏者。

【不良反应】常见皮疹、接触性皮炎、剥脱性皮炎、口干、视物模糊、尿潴留、便秘、白细胞及粒细胞减少甚至缺乏、乏力、头晕、过度镇静、锥体外系反应如急性肌张力障碍、类帕金森综合征、静坐不能、迟发性运动障碍等，偶见阻塞性黄疸、肝大，肠梗阻，肝功能受损溢乳、乳房肿大、月经紊乱或闭经、性功能改变等。首次用药可见直立性低血压、心动过速或过缓、心电图改变。长期使用可引起皮肤、角膜及晶状体色素沉着、恶性综合征等。肌内注射可引起局部硬结。

【用法与用量】(1) 用于精神病，口服，初始剂量一日 25 ~ 50 mg，分 2 ~ 3 次服用，逐渐增至一日 400 ~ 600 mg，

分次服用；肌内注射，一次 25 ~ 50 mg，可根据需要和耐受情况 6 ~ 8 小时重复给药一次；静脉滴注，小剂量开始，25 ~ 50 mg 稀释于 500 ml 葡萄糖氯化钠注射液中缓慢静脉滴注，一日 1 次，每隔 1 ~ 2 日缓慢增加 25 ~ 50 mg，治疗剂量一日 100 ~ 200 mg。年老或体弱者均应注意从小剂量开始，根据耐受情况缓慢加量，注射用药时尤应注意耐受情况，缓慢给药。(2) 用于呕吐，成人一次 12.5 ~ 25 mg，一日 2 ~ 3 次，如不能控制，可注射一次 25 mg。

【制剂与规格】盐酸氯丙嗪片：① 25 mg；② 50 mg。

盐酸氯丙嗪注射液：① 1 ml : 10 mg；② 1 ml : 25 mg；③ 2 ml : 50 mg。

复方盐酸氯丙嗪注射液：① 2 ml : 盐酸氯丙嗪 25 mg，异丙嗪 25 mg；② 5 ml : 盐酸氯丙嗪 50 mg，异丙嗪 50 mg。临床用于：①治疗精神病：用于控制精神分裂症或其他精神病的兴奋骚动、紧张不安、幻觉、妄想等症状，对忧郁症状及木僵症状的疗效较差。②镇吐：几乎对各种原因引起的呕吐均有效。也可治疗顽固性呃逆。但对晕动病呕吐无效。③低温麻醉及人工冬眠、用于低温麻醉时可防止休克发生。人工冬眠时，与哌替啶、异丙嗪配成冬眠合剂用于创伤性休克、中毒性休克、烧伤、高热及甲状腺危象的辅助治疗。④与镇痛药合用，治疗癌症晚期病人的剧痛。⑤治疗心力衰竭。⑥试用于治疗巨人症。深部肌内注射，一次 2 ml。

奋乃静 [基(基)、保(甲)]

Perphenazine

【适应证】用于精神分裂症或其他精神病性障碍，器质性精神病、老年性精神障碍及儿童攻击性行为障碍，各种原因所致的呕吐或顽固性呃逆。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者应减量。(2) 心血管疾病（心功能不全、心肌梗死、心脏传导阻滞）者慎用。(3) 癫痫患者慎用。(4) 出现迟发性运动障碍，应停用所有的抗精神病药。(5) 出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(6) 应定期监测肝功能与白细胞计数。(7) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、昏迷、对吩噻嗪类药物过敏者。

【不良反应】(1) 主要有锥体外系反应，长期大量服药可引起迟发性运动障碍。(2) 可引起血浆中泌乳素浓度增加，可能出现有关的症状为溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。(3) 可出现口干、视物模糊、乏力、头晕、心动过速、便秘、出汗等。(4) 少见直立性低血压，粒细胞减少症与中毒性肝损害。(5) 偶见过敏性皮疹或恶性综合征。

【用法与用量】(1) 口服：①治疗精神分裂症，从小剂量开始，一次 2 ~ 4 mg，一日 2 ~ 3 次。以后每隔 1 ~ 2 日增加 6 mg，逐渐增至常用治疗剂量一日 20 ~ 60 mg。维持剂量一日 10 ~ 20 mg。②用于止呕，一次 2 ~ 4 mg，一日 2 ~ 3 次。(2) 肌内注射：用于精神分裂症，一次 5 ~ 10 mg，6 小时 1 次或根据耐受情况调整用量。(3) 静脉注射：用于精神病，一次 5 mg，氯化钠注射液稀释至 0.5 mg/ml，注射速度每分钟不得超过 1 mg。

【制剂与规格】奋乃静片：①2 mg；②4 mg。

奋乃静注射液：① 1 ml : 5 mg；②2 ml : 5 mg。

氟奋乃静 [保(乙)]

Fluphenazine

【适应证】用于各型精神分裂症，有振奋和激活作用，适用于单纯型、紧张型及慢性精神分裂症的情感淡漠及行为退缩等症状。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者应减量。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用，哺乳期妇女在用药期间应停止哺乳。(3) 心血管疾病（如心功能不全、心肌梗死、心脏传导阻滞）、癫痫患者慎用。(4) 出现过敏性皮疹或恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(5) 应定期监测肝功能与白细胞计数。(6) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森病、

骨髓抑制、青光眼、昏迷及对吩噻嗪类药过敏者。

【不良反应】(1) 锥体外系反应多见。(2) 长期大量使用可发生迟发性运动障碍。(3) 可发生心悸、失眠、乏力、口干、视物模糊、排尿困难、便秘、溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经等。(4) 少见思睡、躁动、眩晕、尿潴留。偶见过敏性皮疹、白细胞减少、恶性综合征、直立性低血压、心悸或心电图改变、中毒性肝损害或阻塞性黄疸、骨髓抑制及癫痫。

【用法与用量】(1) 口服：从小剂量开始，一次 2 mg，一日 2 ~ 3 次。逐渐增至一日 10 ~ 20 mg，最高量一日不超过 30 mg。(2)注射：长效注射剂氟奋乃静，肌内注射，12.5 ~ 50 mg，以后根据病情需要与耐受情况每 2 ~ 4 周重复 1 次。巩固治疗时，根据病情需要与耐受情况，每 3 ~ 4 周肌内注射 50 mg。

【制剂与规格】盐酸氟奋乃静片：① 2 mg；② 5 mg。

氟奋乃静注射液：1 ml : 25 mg。

癸氟奋乃静注射液：1 ml : 25 mg。肌内注射：首次剂量 12.5 ~ 25 mg，每 2 ~ 4 周注射 1 次。以后逐渐增加至一次 25 ~ 75 mg，2 ~ 4 周注射 1 次。

三氟拉嗪[保(甲)]

Trifluoperazine

【适应证】用于各型精神分裂症，具有振奋和激活作用，适用于紧张型的木僵症状及单纯型与慢性精神分裂症的情感淡漠及行为退缩症状。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者应减量。(2) 哺乳期妇女服用本品期间应停止哺乳。(3) 有心血管疾病、癫痫与脑器质性疾病患者慎用。(4) 出现迟发性运动障碍，应停用所有的抗精神病药。(5) 出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(6) 应定期监测肝功能与白细胞计数。(7) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森病、骨髓抑制、青光眼、昏迷及对吩噻嗪类药过敏者。

【不良反应】(1) 锥体外系反应多见，如静坐不能、急性肌张力障碍和类帕金森综合征。(2) 长期大量使用可发生迟发性运动障碍。(3) 可发生心悸、失眠、乏力、口干、视物模糊、排尿困难、便秘、溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经等。少见思睡、躁动、眩晕、尿潴留。偶见过敏性皮疹、白细胞减少及恶性综合征。(4) 偶可引起直立性低血压、心悸或心电图改变、肝酶水平升高或阻塞性黄疸、癫痫。

【用法与用量】口服：从小剂量开始，一次 5 mg，一日 2 ~ 3 次。每隔 3 ~ 4 日逐渐增至一次 5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 3 次。日剂量为 15 ~ 30 mg，最高量为一日 45 mg。

【制剂与规格】盐酸三氟拉嗪片：① 1 mg；② 5 mg。

硫利达嗪[保(乙)]

Thioridazine

【适应证】用于急、慢性精神分裂症。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者、癫痫患者慎用。(2) 若出现过敏性皮疹者应立即停用。(3) 出现恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(4) 用药期间应定期监测肝功能、心电图、白细胞计数，定期行眼科检查。(5) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

【禁忌证】(1) 严重心血管疾病如心力衰竭、心肌梗死、传导阻滞者。(2) 昏迷、白细胞减少者。(3) 对吩噻嗪类及本品过敏者。(4) 严重的中枢神经功能障碍者。(5) 哺乳期妇女。

【不良反应】常见口干、心动过速、视物模糊、嗜睡、头晕、鼻塞、直立性低血压、心电图异常（主要为 T 波异常、QT 间期延长）；偶见腹泻、腹胀、中毒性肝损害。长期用药可引起色素性视网膜病变，大多停药后消失。较少引起震颤、流涎、运动迟缓、静坐不能和急性肌张力障碍等锥体外系不良反应。

【用法与用量】口服：开始剂量为一次 25 mg，一日 3 次，每隔 2 ~ 3 日一次增加 25 mg，逐渐增加至一日 300 ~ 600 mg。

【制剂与规格】硫利达嗪片：① 10 mg；② 25 mg；③ 50 mg；④ 100 mg；⑤ 200 mg。

哌泊塞嗪[保(乙)]

Pipotiazine

【适应证】用于慢性或急性非激越型精神分裂症，对具有妄想和幻觉症状的精神分裂症有较好疗效。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 癫痫、嗜铬细胞瘤、恶性综合征者慎用。(3) 老年人应小剂量开始，如一次 25 mg。(4) 治疗期间亦不宜联合应用其他短效抗精神病药。(5) 开始给药应用小剂量。(6) 定期监测肝功能、血象、血压及心电图。

【禁忌证】(1) 心功能严重损害、意识障碍，特别是中枢抑制药中毒所致的上述情况。(2) 严重抑郁者、恶病质者、肝肾功能不全、嗜铬细胞瘤、青光眼、严重心血管疾病。(3) 可疑有皮质下脑损伤者。(4) 有吩噻嗪药物过敏史者。

【不良反应】(1) 主要有锥体外系反应，常见震颤、强直、静坐不能、动眼危相、反射亢进、流涎等症状，一般在继续治疗或减少剂量时可消除或好转，严重时可使用抗胆碱能药。(2) 可有迟发性运动障碍、睡眠障碍、口干、恶心、低血压、便秘、厌食、月经不调、乏力等。

【用法与用量】肌内注射。一次 50 ~ 200 mg，2 ~ 4 周 1 次，从小剂量开始给药。

【制剂与规格】棕榈哌泊塞嗪注射液：① 2 ml : 50 mg；② 4 ml : 100 mg。

氟哌啶醇[基(基)、保(甲)]

Haloperidol

【适应证】用于急、慢性各型精神分裂症、躁狂症、抽动秽语综合征。控制兴奋躁动、敌对情绪和攻击行为的效果较好。因本品心血管系不良反应较少，也可用于脑器质性精神障碍和老年性精神障碍。

【注意事项】(1) 本品可由乳汁中分泌，导致乳儿镇静和运动功能失调，哺乳期妇女应停止哺乳。(2) 下列情况时慎用：心脏病尤其是心绞痛、药物引起的急性中枢神经抑制、癫痫、肝功能损害、青光眼、甲状腺功能亢进或毒性甲状腺肿、肺功能不全、肾功能不全、尿潴留。(3) 老年人在开始时宜用小量，然后缓慢加量，以免出现锥体外系反应及持久的迟发性运动障碍。(4) 应定期监测肝功能与白细胞计数。(5) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。(6) 孕妇用药。动物实验显示，给予一日最高量 2 ~ 20 倍时，可减少受孕概率，导致滞产与死胎，用于育龄妇女与孕妇时应慎重。

【禁忌证】(1) 基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、严重中枢神经抑制状态者、骨髓抑制、青光眼、重症肌无力者。(2) 对本品过敏者。

【不良反应】(1) 锥体外系反应较重且常见，急性肌张力障碍在儿童和青少年更易发生，出现明显的扭转痉挛，吞咽困难，静坐不能及类帕金森病。(2) 长期大量使用可出现迟发性运动障碍。(3) 可出现口干、视物模糊、乏力、便秘、出汗等。(4) 可引起血浆中泌乳素浓度增加，产生溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。(5) 少数患者可能引起抑郁反应。(6) 偶见过敏性皮疹、粒细胞减少及恶性综合征。

【用法与用量】(1) 口服：用于治疗精神分裂症，起始量一次 2 ~ 4 mg，一日 2 ~ 3 次。渐增至常用量一日 10 ~ 40 mg，维持量一日 4 ~ 20 mg。治疗抽动秽语综合征，见相关章节。(2) 肌内注射：用于控制兴奋躁动，一次 5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 3 次，安静后改为口服。长效注射剂癸哌啶醇，肌内注射，50 ~ 200 mg，以后根据病情需要与耐受情况 2 ~ 4 周重复 1 次。巩固治疗时，根据病情需要与耐受情况，3 ~ 4 周肌内注射 50 ~ 200 mg。

【制剂与规格】氟哌啶醇片：① 2 mg；② 4 mg；③ 5 mg。

氟哌啶醇注射液：1 ml : 5 mg。

氟哌啶醇注射液：1 ml : 25 mg。

五氟利多[保(乙)]

Penfluridol

【适应证】用于急、慢性各型精神分裂症，尤其便于长期服药维持治疗，防止复发。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用。(2) 不适用于老年、体弱或并发躯体病症者。(3) 不宜与其他抗精神病药合

用，以免增加锥体外系反应的发生风险。(4) 应定期监测肝功能与白细胞计数。(5) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制，对本品过敏者。

【不良反应】主要为锥体外系不良反应。一次服药过多或耐受差者，可在服药次日出现急性肌张力障碍，如斜颈、动眼危象或扭转痉挛。出现较重锥体外系反应时，常产生焦虑反应与睡眠障碍。偶见过敏性皮疹、心电图异常、粒细胞减少及恶性综合征。

【用法与用量】口服：一次 10 ~ 40 mg，一周 1 次。以后根据病情递增至每周 60 ~ 120 mg。

【制剂与规格】五氟利多片：① 5 mg；② 20 mg。

氟哌利多 [保 (乙)]

Droperidol

【适应证】用于精神分裂症和躁狂症兴奋状态，或与芬太尼合用于神经安定镇痛术。

【注意事项】(1) 下列情况时慎用：心脏病尤其是心绞痛、药物引起的急性中枢神经抑制、癫痫、肝功能损害、青光眼、甲状腺功能亢进或毒性甲状腺肿、肺功能不全、肾功能不全及尿潴留。(2) 治疗期间应定期检查血常规、肝功能。(3) 妊娠期妇女、儿童、老年人慎用，哺乳期妇女使用本品期间应停止哺乳。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、严重中枢神经抑制状态、抑郁症及对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 锥体外系反应较重且常见，急性肌张力障碍在儿童和青少年更易发生，出现明显的扭转痉挛、吞咽困难、静坐不能及类帕金森病。(2) 可出现口干、视物模糊、乏力、便秘、出汗等。(3) 可引起血浆中泌乳素浓度增加，可能有关的症状为溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。(4) 少数患者可能引起抑郁反应。(5) 可引起注射局部红肿、疼痛、硬结。(6) 较少引起低血压。(7) 偶见过敏性皮疹及恶性综合征。

【用法与用量】(1) 用于控制急性精神病的兴奋躁动：肌内注射一日 5 ~ 10 mg。(2) 用于神经安定镇痛：5 mg 与枸橼酸芬太尼 0.1 mg，在 2 ~ 3 分钟缓慢静脉注射。

【制剂与规格】氟哌利多注射液：2 ml : 5 mg。

氯普噻吨 [保 (乙)]

Chlorprothixene

【适应证】用于急性和慢性精神分裂症，适用于伴有精神运动性激越、焦虑、抑郁症状的精神障碍。

【注意事项】(1) 出现过敏性皮疹及恶性症状群应立即停药并进行相应的处理。(2) 肝肾功能不全者应减量。(3) 心血管疾病（如心功能衰竭、心肌梗死、心脏传导阻滞）者慎用。(4) 癫痫患者慎用。(5) 如出现迟发性运动障碍，应停用所有的抗精神病药。(6) 定期监测肝功能与白细胞计数。(7) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。(8) 孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、尿潴留、昏迷及对本品过敏者。

【不良反应】(1) 大量或增加药量时容易出现的不良反应有血压降低、肌肉僵直以颈背部尤为明显，不停踱步，双手或手指震颤或抖动，头部、面部、口部或颈部的肌肉抽搐等。(2) 少见迟发性运动障碍、皮疹、接触性皮炎；罕见粒细胞减少症、眼部细微沉积物、黄疸等。

【用法与用量】口服。用于治疗精神分裂症，成人常用量开始一次 25~50 mg，一日 2 ~ 3 次。然后根据临床需要与耐受程度增至一日 400 ~ 600 mg。老年、体弱者须从小剂量开始，缓慢增至可耐受的较低的治疗用量。6 ~ 12 岁儿童常用量一次 10 ~ 25 mg，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】氯普噻吨片：① 12.5 mg；② 15 mg；③ 25 mg；④ 50 mg。

氟哌噻吨[保(乙)]

Flupentixol

【适应证】用于急慢性精神分裂症，尤对情感淡漠、退缩症状效果好。其癸酸酯长效针剂可用于预防复发的长期维持治疗。小剂量用药有稳定情绪、抗焦虑和抗轻度抑郁的效果。

【注意事项】兴奋、激越患者不宜使用。本药可加强乙醇、巴比妥类等药物的镇静作用和中枢神经系统的抑制作用，降低哌乙啶、肾上腺素能、左旋多巴的作用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 严重肝、肾功能损害者。(3) 心脏病患者。(4) 急性中毒、昏迷、谵妄者。(5) 妊娠头3个月。

【不良反应】主要为锥体外系症状，表现为肌张力增高、震颤、静坐不能，服抗胆碱能药物如苯海索可缓解。偶可见口干、便秘、头晕和失眠。对心、肝、肾、造血系统未见明显毒性作用。

【用量与用法】(1) 口服：初始剂量一日5 mg，一日1次，1周内渐增至一日3次，一次10 mg，必要时可加到一日40 mg，分2～3次服用。维持治疗，5～20 mg，一日1次。(2)癸酸酯为长效制剂，每次肌内注射20 mg，疗效维持2～3周。如病情稳定可20 mg每4周1次。

【制剂与规格】氟哌噻吨片：① 0.5 mg；② 3 mg；③ 5 mg。

氟哌噻吨癸酸酯注射液：1 ml：20 mg。

氟哌噻吨美利曲辛片：每片含氟哌噻吨0.5 mg和美利曲辛10 mg。用于轻及中型焦虑－抑郁－虚弱神经衰弱、心因性抑郁，抑郁性神经官能症，隐匿性抑郁，心身疾病伴焦虑和情感淡漠，更年期抑郁，嗜酒及药瘾者的焦躁不安及抑郁。口服：成人，通常一日2片，早晨及中午各1片；严重病例早晨的剂量可加至2片。老年病人，早晨服1片即可。维持量，通常一日1片，早晨口服。对失眠或严重不安的病例，建议在急性期加服镇静药。

氯哌噻吨[保(乙)]

Clopenthixol

【适应证】精神分裂症，对思维及感知觉障碍如妄想、幻觉等症状有较好疗效，对兴奋躁动、行为障碍能较快控制。恢复期患者长期用药可预防复发，对慢性病人可改善症状。用于躁狂症，对双相情感性精神障碍的躁狂发作有强镇静作用，能较快地控制兴奋躁动、多语等症状。对精神发育迟滞、老年性痴呆等伴发的精神症状也有疗效。老年人只用小剂量。

【注意事项】可与其他硫杂蒽类药物及吩噻嗪类药物有交叉过敏反应。肝肾功能不全、兴奋躁动患者慎用。

【禁忌证】严重心、肝、肾功能不全者，有惊厥病史、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】主要为锥体外系反应，可出现肌张力增高、震颤、静坐不能等，使用苯海索类可减轻。大剂量时可出现头晕、乏力、嗜睡、口干等，多见于治疗开始的2周内，坚持治疗或减量可逐渐减轻至消失。

【用法与用量】注意个体化原则、从小剂量开始，根据疗效反应逐步调整至合适剂量，不合并其他抗精神病药物为宜。片剂：初始剂量，一次10 mg，一日1次；治疗剂量，首剂后每2～3日增加5～10 mg，根据疗效可增至一日80 mg，分2～3次口服；维持剂量，一日10～40 mg，1次口服。速效针剂：50～150 mg深部肌内注射，一般每72小时注射1次，但累计总量不超过400 mg，老年患者应适当减量且每次注射不宜超过100 mg，儿童不宜使用速效针剂。长效针剂：剂量及用药间隔应根据治疗反应调整，一般200 mg肌内注射，每2～4周深部肌内注射1次。

【制剂与规格】氯哌噻吨片：10 mg。

氯哌噻吨注射液：①速效针剂，1 ml：50 mg；②长效针剂，1 ml：200 mg。

舒必利[保(甲)]

Sulpiride

【适应证】用于精神分裂症单纯型、偏执型、紧张型、及慢性精神分裂症的孤

僻、退缩、淡漠症状。对抑郁症状有一定疗效，且可用于止呕。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者应减量。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用，哺乳期妇女服药期间应停止哺乳。(3) 高血压者、癫痫、基底神经节病变、帕金森综合征、严重中枢神经抑制状态者慎用。(4) 如出现迟发性运动障碍，应停用所有的抗精神病药。(5) 出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(6) 用药期间定期监测肝肾功能和血象。

【禁忌证】嗜铬细胞瘤、高血压患者、严重心血管疾病和严重肝病患者、对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 常见失眠、早醒、头痛、烦躁、乏力、食欲缺乏、口干、视物模糊、心动过速、排尿困难与便秘等抗胆碱能不良反应。(2) 剂量大于一日 600 mg 时可出现锥体外系反应，如震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。(3) 较多引起血浆中泌乳素浓度增加，可能有关的症状为溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经、体重增加。(4) 可出现心电图异常和肝功能损害。(5) 少数患者可发生兴奋、激动、睡眠障碍或血压升高。(6) 长期大量服药可引起迟发性运动障碍。

【用法与用量】口服：①用于治疗精神分裂症，开始剂量为一次 100 mg，一日 2 ~ 3 次，逐渐增至治疗量一日 400 ~ 800 mg，维持剂量为一日 200 ~ 600 mg。②用于止呕，一次 50 ~ 100 mg，一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】舒必利片：100 mg。

舒必利注射液：① 2 ml : 50 mg；②2 ml : 100 mg。

氨磺必利 [保(乙)]

Amisulpride

【适应证】用来治疗精神疾病，尤其是伴有阳性症状(如谵妄、幻觉、认知障碍)和(或)阴性症状(如反应迟缓、情感淡漠及社会能力退缩)的急性或慢性精神分裂症，也包括以阴性症状为主的精神病患。

【注意事项】(1) 对于肾功能不全，肌酐清除率为每分钟 30 ~ 60 ml 的患者，应将剂量减半，对于肌酐清除率为每分钟 10 ~ 30 ml 的患者，应将剂量减至 1/3。(2) 对于有惊厥史的病人，服用氨磺必利时应仔细监控。(3) 由于老年人对药物的高敏感性，所以老年人服药时应注意。(4) 对于患有帕金森病的患者，服药时应注意。除非必须使用精神抑制类药物治疗，否则应避免服用此药。(5) 对于司机和机器操作者，应特别注意，服用此药可出现瞌睡症状。(6) 妊娠期间最好不使用本品。

【禁忌证】本品不能用于下列情况：已知对药品中某成分过敏者，已知患有或怀疑患有嗜铬细胞瘤的患者，15 岁以下的儿童，哺乳期妇女，已知患有或怀疑患有催乳素依赖性癌症的病人，严重肾功能不全者，先天性半乳糖血症、葡萄糖或半乳糖吸收不良综合征或乳糖酶缺乏的患者。

【不良反应】(1) 经常发生的不良反应：血中催乳素水平升高，可引起乳溢、闭经、男子乳腺发育、乳房肿胀、阳痿、女性的性冷淡，停止治疗，可恢复；体重增加；可产生锥体外系综合征(震颤、肌张力亢进、流涎、静坐不能、运动功能减退)。(2) 很少发生的不良反应：嗜睡；胃肠道功能紊乱，如便秘、恶心、呕吐、口干。(3) 极少发生的不良反应：可出现急性肌张力障碍(痉挛性斜颈、眼球转动危象、牙关紧闭等症状)；可引起迟发性运动障碍，尤其是延长服药后，主要症状为不自主的舌或脸部运动；可引起低血压和心动过缓；可引起 QT 间期延长，极少情况下可引起尖端扭转型室性心动过速；过敏反应；惊厥；恶性综合征。

【用法与用量】通常情况下，若一日剂量≤ 400 mg，应一次服完；若一日剂量超过 400 mg，应分为 2 次服用。阴性症状占优势阶段：推荐剂量为一日 50 ~ 300 mg。剂量应根据个人情况进行调整。最佳剂量约为一日 100 mg。阳性及阴性症状混合阶段：治疗初期，应主要控制阳性症状，剂量可为一日 400 ~ 800 mg。然后根据患者的反应调整剂量至最小有效剂量。

【制剂与规格】氨磺必利片：0.2 g。

舒托必利[保(乙)]

Sultopride

【适应证】用于伴有兴奋躁动的精神分裂症、躁狂症及智力发育不全、酒精中毒所致的伴有兴奋躁动精神障碍。

【注意事项】(1) 心血管病、甲状腺功能亢进、癫痫、高龄及脱水、营养不良患者慎用。(2) 服药期间应定期检查血象及心、肝、肾功能。(3) 服用本品者不得从事高空作业、驾驶等危险性较高的工作。(4) 妊娠或可能已妊娠的妇女使用时需权衡利弊。(5) 老年患者慎用。

【禁忌证】以下患者禁用：①对本品成分过敏者；②心、肝、肾等重要器官功能不全，抑郁症、帕金森病、不稳定的癫痫患者；③中枢神经系统明显抑制以及对巴比妥等中枢神经抑制药反应强烈的患者；④可能有过脑损伤（脑炎、脑肿瘤、头部外伤后遗症等）患者；⑤心率低于每分钟65次的患者；⑥低血钾患者；⑦已知与敏感药物合用会发生心动过缓、房室传导阻滞、尖端扭转性室性心动过速等心律失常的患者；⑧哺乳期妇女禁用。

【不良反应】常见锥体外系反应，如肌强直、扭转性活动、静坐不能、震颤，减量或加服苯海索等抗胆碱能药物后，症状可减轻或消失。少见有失眠、心动过速、兴奋或激越；偶见情绪忧郁、视物模糊、头痛、头晕、镇静或昏睡、口干、便秘、皮疹、胃肠道反应、肝功能一过性异常等。

【用法与用量】肌内注射：一次100~200 mg，一日1～2次，一日最大剂量为300 mg。

【制剂与规格】盐酸舒托必利注射液：2 ml ∶ 200 mg。

氯氮平[保(甲)]

Clozapine

【适应证】用于急性和慢性精神分裂症的各亚型，对幻觉妄想型、青春型效果好，也可减轻与精神分裂症有关的情感症状。也用于治疗躁狂症和其他精神病性障碍的兴奋躁动和幻觉妄想。因导致粒细胞减少症，一般不宜作为首选。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女服药期间应停止哺乳。(2) 闭角型青光眼患者、前列腺增生、痉挛性疾病或病史者、癫痫患者、心血管疾病者慎用。(3) 12岁以下儿童应慎用。(4) 老年患者可能对氯氮平的抗胆碱作用特别敏感，易发生尿潴留、便秘等。(5) 用药前2个月出现持续心动过速时，需注意检测心肌炎或心肌病的有关指标。(6) 开始治疗之前与治疗后的前3个月应每周监测白细胞计数与分类。(7) 定期监测肝功能、心电图及血糖。(8) 用药时不宜从事驾驶或机器操作等工作。

【禁忌证】(1) 严重心肝肾疾病患者、昏迷、谵望、低血压、癫痫、青光眼、骨髓抑制、白细胞减少者。(2) 对本品过敏者。(3) 妊娠期妇女。

【不良反应】(1) 常见头晕、乏力、困倦、多汗、流涎、恶心、呕吐、口干、便秘、心动过速、直立性低血压、体重增加、血糖增加和血脂增加。(2)少见不安、易激惹、精神错乱、视物模糊、血压升高及严重持续性头痛。这些反应与剂量有关。(3) 罕见粒细胞减少或缺乏，可为致死性的。也有血小板减少的报道。(4) 其他可见体温升高，如同时产生肌强直和自主神经并发症时，须排除恶性综合征。可引起心电图异常、脑电图异常和癫痫发作。

【用法与用量】口服：初始剂量为一次25 mg，一日2～3次，然后一日增加25～50 mg，如耐受良好，在开始治疗的第2周末将一日总量可增至常用治疗量200～400 mg。如病情需要，可继续每周加量1～2次，每次增加50～100 mg。维持剂量一日200～400 mg，最高日剂量不超过600 mg。

【制剂与规格】氯氮平片：① 25 mg；② 50 mg。

利培酮[保(乙)]

Risperidone

【适应证】用于精神分裂症，躁狂发作。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全慎用，使用时起始及维持剂量应减半，剂量调整应减缓。(2) 孕妇服用本品安全性尚不明确，除非益处明显大于可能的危险，否则不应服用本品；动物实验表明，利培酮

和9-羟利培酮可由乳汁分泌，哺乳期妇女在服药期间应停止哺乳。(3) 心血管疾病、低血压、脱水、失血及脑血管病变的患者、帕金森病、癫痫患者慎用。用药时不宜从事驾驶或机器操作等工作。(4) 使用时应小剂量起始，加量宜慢。(5) 对于精神分裂症，尚缺乏15岁以下儿童足够的临床经验。对于躁狂发作，尚缺乏18岁以下儿童及青少年的足够临床经验。(6) 建议老年人起始剂量为一日0.5 mg或更低，根据个体需要，剂量渐增至一次1～2 mg，一日2次。在获得更多的经验前，老年人加量应慎重。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 常见失眠、焦虑、激越、头痛、头晕、口干。(2) 可引起锥体外系反应；可引起体重增加。(3) 少见过度镇静、乏力、注意力下降、便秘、消化不良、恶心、呕吐、腹痛、视物模糊、性功能障碍、男性乳房发育、泌乳、月经紊乱、尿失禁、血管性水肿、鼻炎、皮疹及其他过敏反应、直立性低血压、反射性心动过速、高血压、肝功能异常。(4) 偶见迟发性运动障碍、恶性综合征、体温失调和癫痫发作；有轻度中性粒细胞和血小板计数下降的个例报道；罕见心电图QT间期延长的报道。

【用法与用量】(1) 口服：成人一般初始剂量为一次1 mg，一日1～2次，以后每隔3～5日酌情增加1 mg，一般剂量为4～6 mg，分1～2次服用。一日剂量一般不超过10 mg。老年患者初始剂量为一次0.5 mg，一日1次，根据耐受情况每次酌情增加0.5 mg，一般治疗剂量为1～4 mg，分两次服，高龄患者通常日剂量1～2 mg。(2)深部肌内注射：一次25 mg，2周1次。

【制剂与规格】利培酮片：①1 mg；②2mg。利培酮口服液：1 ml：1 mg。

注射用利培酮微球：①25 mg；②37.5 mg；③50 mg。

帕利哌酮[保(乙)]

Pailperidone

【适应证】用于精神分裂症急性期。

【注意事项】(1) 可能增高痴呆相关性精神病老年患者的病死率，本品尚未批准用于治疗痴呆相关性精神病。(2) 中、重度肾损害患者可出现清除率下降，宜减少剂量。有时可能需要监测肾功能。(3) 妊娠期间使用本品需权衡利弊，因有报道，在妊娠的最后3个月使用第一代抗精神病药，新生儿可能发生锥体外系症状。(4) 哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】已知对帕利哌酮、利培酮或本品所含组分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 脑血管不良反应，包括卒中，痴呆相关性精神病老年患者。(2) 抗精神病药恶性综合征。(3) QT间期延长。(4) 迟发性运动障碍。(5) 高血糖和糖尿病。(6) 高催乳素血症。(7) 胃肠梗阻。(8) 直立性低血压和晕厥。(9) 可能的认知和运动功能障碍。(10) 癫痫。(11) 吞咽困难。(12) 自杀。(13) 阴茎异常勃起。(14)血栓性血小板减少性紫癜。(15) 体温调节功能破坏。

【用法与用量】口服：一次6 mg，一日1次，早上服用。根据其反应或需要，可每5日增加3 mg，但一日最大剂量为12 mg。

【制剂与规格】帕利哌酮缓释片：6 mg。

奥氮平[保(乙)]

Olanzapine

【适应证】用于精神分裂症，躁狂发作，预防双相情感障碍的复发。

【注意事项】(1) 严重肾功能损害或中度肝功能损害者，起始剂量为5 mg。(2) 妊娠妇女慎用；本品可由乳汁分泌，哺乳期妇女用药期间应停止哺乳。(3) 有低血压倾向的心血管和脑血管疾病、前列腺增生、麻痹性肠梗阻、肝功能损害、癫痫患者慎用。任何原因所致粒细胞降低者慎用。(4) 老年患者起始剂量为5 mg。(5) 尚无在18岁以下人群中的研究报道。(6) 用药时不宜从事驾驶或机器操作等工作。(7) 不推荐高血糖及糖尿病患者使用。(8) 不推荐用于帕金森病及与多巴胺激动剂相关的精神病。

【禁忌证】对本品过敏者、闭角型性青光眼。

【不良反应】(1) 常见困倦、体重增加、帕金森病者症状恶化、食欲增加、血糖水平升高、三酰甘油水平升高、头晕、帕金森症状、运动障碍、轻度而短暂的抗胆碱能反应、直立性低血压、治疗早期一过性的 ALT 及 AST 升高、血清泌乳素水平升高，但罕见相关临床表现。(2) 偶见心动过缓、光敏反应、嗜酸性粒细胞增多。(3) 罕见或极罕见白细胞减少、皮疹、变态反应、高胆固醇血症、体温过低、尿潴留、阴茎异常勃起、血小板减少、中性粒细胞减少、横纹肌溶解、肝炎、胰腺炎。

【用法与用量】口服：建议起始剂量为一日 10 mg，根据病情和耐受情况调整剂量，治疗剂量为一日 5 ~ 20 mg。非吸烟的老年女性、有低血压倾向者、严重肾功能损害或中度肝功能损害病人，起始剂量为 5 mg，逐步递增剂量，一次 5 mg，间期至少 1 周。

【制剂与规格】奥氮平片：① 5 mg；② 10 mg。

喹硫平 [保（乙）]

Quetiapine

【适应证】用于精神分裂症，躁狂发作。

【注意事项】(1) 孕妇慎用，哺乳期妇女在用药时应停止哺乳。(2) 心脑血管疾病或其他有低血压倾向者、肝肾功能损害、甲状腺疾病或抽搐史者慎用。(3) 与可延长心电图 QT 间期的药物合用时应慎重。长期用药应注意有无白内障的发生。(4) 儿童和青少年人群中的安全性和有效性尚未进行评价。(5) 老年人易发生直立性低血压，剂量宜小。(6) 用药时不宜从事驾驶或机器操作等工作。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 常见困倦、头晕、口干、便秘、消化不良、ALT 及 AST 升高、轻度无力、鼻炎、心动过速、直立性低血压、白细胞减少。(2) 偶见嗜酸性粒细胞增多、血清三酰甘油和胆固醇水平增高、甲状腺素水平降低、癫痫。(3) 罕见恶性综合征和阴茎异常勃起。

【用法与用量】口服：①用于精神分裂症，第 1 日 50 mg，第 2 日 100 mg，第 3 日 200 mg，第 4 日 300 mg，以后根据患者临床反应和耐受性逐渐调整剂量为一日 150 ~ 750 mg，分 2 次服。②用于双相情感障碍躁狂发作，推荐初始剂量一日 100 mg，分 2 次口服，一日增量 100 mg，可在第 6 日加至 800 mg，一日增量不超过 200 mg，一般一日剂量为 400 ~ 800 mg。老年患者起始剂量一日 25 mg，一日加量 25 ~ 50 mg，分 2 次服用，有效剂量可能较一般年轻患者低。

【制剂与规格】富马酸喹硫平片：① 25 mg；② 100 mg；③ 200 mg。

阿立哌唑 [保（乙）]

Aripiprazole

【适应证】用于精神分裂症。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女慎用；哺乳期妇女在服药期间应停止哺乳。(2) 心脑血管疾病、肝功能损害、易发生低血压者、癫痫、有患吸入性肺炎风险、脱水患者慎用。(3) 儿童和青少年患者用药的安全性和有效性尚未确立，应慎用。(4) 老年人使用时一般不需调整剂量，但嗜睡、吸入性肺炎的发生率增加。(5) 不推荐用于痴呆相关精神障碍。(6) 用药时不宜从事驾驶或机器操作。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见头痛、头晕、目眩、失眠、困倦、静坐不能、心动过速、直立性低血压；罕见心电图 QT 间期延长、恶心、呕吐、便秘；体重增加、高血糖、血清催乳素浓度升高，有发生恶性综合征的报道。

【用法与用量】口服：初始剂量一次 10 mg，一日 1 次，用药 2 周后可根据疗效和耐受情况渐增剂量，最大剂量一日 30 mg。

【制剂与规格】阿立哌唑片：① 5 mg；② 10 mg。

阿立哌唑口崩片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

齐拉西酮 [保（乙）]

Ziprasidone

【适应证】用于精神分裂症。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女慎用；哺乳期妇女在用药期间应停止哺乳。(2) 心

动过缓、低钾血症或低镁血症者、吞咽困难者、癫痫患者、恶性综合征病史者慎用。(3) 未被批准用于治疗痴呆相关的精神障碍。(4) 用药时不宜从事驾驶或机器操作等工作。

【禁忌证】对本品过敏者、有心电图QT间期延长病史者、近期有急性心肌梗死者、非代偿性心力衰竭者、有心律失常病史者。

【不良反应】常见过度镇静、静坐不能、恶心、便秘、消化不良和类鼻炎症状；可见锥体外系反应、心血管不良反应、体重增加、高催乳素血症；罕见直立性低血压和心动过速。

【用法与用量】(1) 口服：初始剂量一次 20 mg，一日 2 次，餐时服用，视病情可渐增至一次 80 mg，一日 2 次，剂量调整间隔一般不应少于 2 日。(2) 肌内注射：一次 10 ~ 20 mg，给药间隔不少于 4 小时，一日用药不超过 4 次。

【制剂与规格】盐酸齐拉西酮胶囊：① 20 mg；② 40 mg；③ 60 mg；④ 80 mg。

注射用甲磺酸齐拉西酮：5 mg。

第 2 章 呼吸系统疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 哮喘
- 慢性阻塞性肺疾病
- 咳嗽

2.1 哮喘及其用药

哮喘（asthma）的治疗药物包括肾上腺素 β_2 受体激动药、抗胆碱药、支气管平滑肌舒张药、茶碱、糖皮质激素、色甘酸钠和奈多罗米钠以及白三烯受体拮抗药。

2.1.1 哮喘急性发作时的病情严重度判断和治疗原则

哮喘急性发作的治疗取决于发作的严重程度及对治疗的反应。治疗的目的在于尽快缓解症状，解除气流受限和改善低氧血症（表 2-1，表 2-2）。

表 2-1 哮喘急性发作时病情严重程度的分级

临床特点	轻 度	中 度	重 度	危 重
气短	步行、上楼时	稍事活动	休息时	
体位	可平卧	喜坐位	端坐呼吸	
讲话方式	连续成句	单词	单字	不能讲话
精神状态	可有焦虑，尚安静	时有焦虑或烦躁	常有焦虑、烦躁	嗜睡或意识模糊
出汗	无	有	大汗淋漓	
呼吸频率	轻度增加	增加	常有>每分钟 30 次	
辅助呼吸肌活动及三凹征	常无	可有	常有	胸腹矛盾运动
哮鸣音	散在，呼吸末期	响亮、弥漫	响亮、弥漫	减弱、乃至无

（续 表）

临床特点	轻度	中度	重度	危重
脉率（次／分钟）	< 100	100 ~ 120	> 120	
奇脉	无	可有	常有	脉率变慢或不规则
吸气时收缩压下降	< 10 mmHg	10 ~ 25 mmHg	> 25 mmHg（成人），20 ~ 40 mmHg（儿童）	无，提示呼吸肌疲劳
最初吸入支气管扩张药治疗后PEF占预计值或个人最佳值（%）	> 80%	60% ~ 80%	< 60%或<每分钟 100 L 或作用持续时间< 2 小时	
PaO_2（吸空气，mmHg）	正常	≥ 60	< 60	
$PaCO_2$（mmHg）	< 45	≤ 45	> 45	
SaO_2（吸空气，%）	> 95	91 ~ 95	≤ 90	
pH	正常	正常或升高	降低	降低

表 2-2 成人哮喘急性发作的一般治疗策略

轻、中度	中、重度	重度和危重
重复吸入速效 β_2 受体激动药 若上述治疗反应不完全，口服糖皮质激素	应去急诊或医院治疗 氧疗 重复吸入速效 β_2 受体激动药（储雾器给药或射流雾化装置） 可联合使用 β_2 受体激动药和抗胆碱能制剂 尽早使用全身性糖皮质激素口服，严重者静脉注射或滴注 如口服：泼尼松龙 30 ~ 50 mg 静注或滴注：甲泼尼龙 80 ~ 160 mg 氢化可的松 400 ~ 1 000 mg（分次）	同中、重度 机械通气治疗 指征：意识改变、呼吸肌疲劳、$PaCO_2$ ≥ 45 mmHg 无创或有创

老年人、充血性心力衰竭或肝功能损害者应酌减量，为正常用量的 1/3 ~ 1/2，如有条件应监测茶碱血药浓度，如同时应用大环内酯类、H_2 受体拮抗药、氟喹诺酮类药物时，茶碱剂量应酌减

2.1.2 哮喘病情的分级和长期治疗方案（5 岁以上患者）

（1）哮喘病情严重程度的分级：主要用于治疗前或初始治疗时严重程度的判断（表 2-3，表 2-4）。

（2）哮喘病情控制水平的分级：有助于指导临床治疗以取得更好的哮喘控制。

（3）长期治疗方案的确定：哮喘是一种慢性呼吸道疾病，要根据病情及治疗反应制定个体化的长期治疗方案。治疗哮喘的药物分为控制药物（糖皮质激素、白三烯受体拮抗药）和缓解药物（如速效 β_2 受体激动药等）。控制药物需要长期使用，缓解药物按需使用。哮喘患者长期治疗方案可分为 5 步，见表 2-5。对于初诊哮喘患者可选择第 2 步治疗方案，若哮喘患者病情较重，直接选择第 3 步治疗方案。如果治疗方案不能使哮喘得到控制，应升级治疗直至达到哮喘控制为止。当哮喘控制并维持至少 3 个月，治疗方案可以降级治疗。常用吸入型糖皮质激素的每天剂量与互换关系，见表 2-6。5 岁以下儿童常用吸入型糖皮质激素的每日剂量与互换关系，见表 2-7。

2.1.3 哮喘的药物治疗

吸入：此途径可使药物直接进入气道，比口服所需药物剂量小，且不良反应少。压力型定量手控吸入器是很多治疗哮喘药物有效便捷的给药方法。储雾罐装置能提高给药效率，尤其对于15岁以下儿童和使用压力型定量手控吸入器有困难的患者；储雾罐还能减少吸入糖皮质激素引起的局部不良反应。呼吸激活型吸入器和干粉吸入器也是有效的药物吸入装置。

溶液雾化器适用于急性重症哮喘时的治疗。药物由氧气或压缩空气驱动，通过雾化器给予5～10分钟，此方法通常在医院使用。电动空气压缩机最宜于家庭治疗。

表 2-3 治疗前哮喘病情严重程度的分级

分 级	临床特点
间歇状态（第1级）	症状＜一周1次 短暂出现 夜间哮喘症状≤1个月2次 FEV_1≥80%预计值或PEF≥80%个人最佳值 PEF或FEV_1变异率＜20%
轻度持续（第2级）	症状≥一周1次，但＜一日1次 可能影响活动和睡眠 夜间哮喘症状＞1个月2次，但＜一周1次 FEV_1≥80%预计值或PEF≥80%个人最佳值 PEF或FEV_1变异率20%～30%
中度持续（第3级）	一日有症状 影响活动和睡眠 夜间哮喘症状≥一周1次 FEV_1 60%～79%预计值或PEF 60%～79%个人最佳值 PEF或FEV_1变异率＞30%
重度持续（第4级）	一日有症状 频繁出现 经常出现夜间哮喘症状 体力活动受限 FEV_1＜60%预计值或PEF＜60%个人最佳值 PEF或FEV_1变异率＞30%

表 2-4 治疗期间哮喘病情控制水平分级

	完全控制（满足以下所有条件）	部分控制（在任何一周内出现以下1～2项特征）	未控制（在任何一周内）
白天症状	无（或≤2次/周）	＞2次/周	
活动受限	无	有	
夜间症状/憋醒	无	有	出现≥3项部分控制特征
需要使用急救药的次数	无（或≤2次/周）	＞2次/周	
肺功能（PEF或FEV_1）	正常	＜正常预计值（或本人最佳值）的80%	
急性发作	无	一年＞1次	在任何一周内出现1次

表 2-5 哮喘病情控制分级治疗方案（用于 5 岁以上患者）

病情控制分级	治疗措施
完全控制	使用最少的药物维持控制
部分控制	升级治疗达到控制
未控制	
急性发作	

降级 ← 治疗步骤 → 升级

第 1 级	第 2 级	第 3 级	第 4 级	第 5 级
哮喘教育、环境控制				
按需使用短效 β_2 受体激动药	按需使用短效 β_2 受体激动药			
控制性药物	选用一种	选用一种	加用一种或以上	加用一种或两种
	低剂量的 ICS	低剂量的 ICS 加 LABA	中高剂量的 ICS 加 LABA	口服最小剂量的糖皮质激素
	白三烯调节药	中高剂量的 ICS	白三烯受体拮抗药	抗 IgE 治疗
		低剂量的 ICS 加白三烯受体拮抗药	缓释茶碱	
		低剂量的 ICS 加缓释茶碱		

ICS：吸入糖皮质激素；LABA：长效 β_2 受体激动药

表 2-6 常用吸入型糖皮质激素的每日剂量与互换关系

药 物	低剂量（μg）	中剂量（μg）	高剂量（μg）
二丙酸倍氯米松	200 ~ 500	500 ~ 1 000	1 000 ~ 2 000
布地奈德	200 ~ 400	400 ~ 800	800 ~ 1 600
丙酸氟替卡松	100 ~ 250	250 ~ 500	500 ~ 1 000

表 2-7 5 岁以下儿童常用吸入型糖皮质激素的每日剂量与互换关系

药 物	低剂量（μg）	中剂量（μg）	高剂量（μg）
二丙酸倍氯米松	100 ~ 200	200 ~ 4 000	＞ 400
布地奈德	100 ~ 200	200 ~ 4 000	＞ 400
布地奈德雾化悬液	200 ~ 500	500 ~ 1 000	＞ 1 000
丙酸氟替卡松	100 ~ 200	200 ~ 500	＞ 500

口服：当无法吸入给药时应口服给药，但其全身不良反应的发生频率比吸入途径更频繁。口服治疗哮喘的药物包括 β_2 受体激动药、糖皮质激素、茶碱及白三烯受体拮抗药。

注射：在急性重症哮喘的治疗中，当雾化吸入药物不适宜或不够量时，β_2 受体激动药、糖皮质激素和氨茶碱等可静脉注射。急性重症哮喘患者不宜在社区医院接受治疗，应紧急转至综合医院救治。

（1）孕期和哺乳期哮喘：对妊娠期的哮喘患者病情进行良好控制，是十分重要的。若孕期哮喘病情达到良好控制时，一般哮喘对妊娠、生产或者胎儿无重要影响。妊娠期哮喘的药物治疗尽量选用吸入给药途径，使胎儿受影响最少。计划妊娠的哮

喘妇女应定期告知使用药物的重要性，以保持哮喘得到良好控制。

严重的哮喘急性发作可给妊娠带来不良后果，应及时给予常规治疗，包括口服或静脉注射糖皮质激素以及雾化吸入 β_2 受体激动药。泼尼松龙进入胎儿体内的量较少，选择口服时优先选用。此外，应立即给予氧疗，使氧饱和度维持在95%以上，防止母亲和胎儿缺氧。

吸入药物、茶碱和泼尼松龙在妊娠及哺乳期可正常使用。

(2) 急性重症哮喘：急性重症哮喘可以致命，因此必须及时治疗。应该给予氧疗，通过大容量储雾罐或溶液雾化器吸入沙丁胺醇或特布他林及异丙托溴铵（在出现威胁生命特征时应使用溶液雾化器），并给予全身性糖皮质激素。成人可给予口服泼尼松龙 40 ~ 50 mg 或静脉注射泼尼松龙磷酸钠 40 mg，亦可静脉注射氢化可的松100 mg（氢化可的松琥珀酸钠更好）。对于儿童患者，给予口服泼尼松龙 1 ~ 2 mg/kg（1 ~ 4 岁患者最大剂量 20 mg，5 ~ 15 岁患者最大剂量 40 mg）或静脉注射氢化可的松（氢化可的松琥珀酸钠更好）（1 岁以下 25 mg，1 ~ 5 岁 50 mg，6 ~ 12 岁 100 mg）。如果出现呕吐，则首剂可以应用静脉途径。对重症可能危及生命的哮喘患者，应及时选择静脉途径给药，剂量较大，如成人给予氢化可的松琥珀酸钠（一日 400 ~ 1 000 mg）或甲泼尼龙琥珀酸钠（一日 80 ~ 160 mg）；儿童患者则根据体重适当调整剂量。无糖皮质激素依赖倾向者，可在短期（3 ~ 5 日）内停药；有糖皮质激素依赖倾向者应延长给药时间，在控制哮喘症状后改为口服给药，并逐步减少用量。

由于 β_2 受体激动药静脉给予时的不良反应较多，大多数情况下不推荐选择静脉给药途径。

茶碱常用于成人哮喘患者，口服用药适用于轻、中度哮喘发作和维持治疗。每天剂量按体重 6 ~ 10 mg/kg。控（缓）释型茶碱平喘作用可维持 12 ~ 24 小时，适用于夜间哮喘症状的控制。茶碱与糖皮质激素和抗胆碱药联合应用具有协同作用，与 β_2 受体激动药联合应用时，易出现心率增快和心律失常等不良反应，应适当减少剂量。静脉用药适用于哮喘急性发作，对近 24 小时内未用过茶碱类药物的患者，负荷剂量为 4 ~ 6 mg/kg，维持剂量为 0.6 ~ 0.8 mg/kg，需静脉滴注或缓慢静脉注射。

硫酸镁可能对治疗重症哮喘急性发作患者有一定疗效，但临床获益的循证依据有限，不推荐常规使用；应用硫酸镁 1.2 ~ 2 g，静脉滴注时间需超过 20 分钟，或雾化吸入 2.5 ml 硫酸镁（60 mg/ml）和 2.5 ml 沙丁胺醇雾化溶液（1 mg/ml）配制成等渗溶液进行治疗。

在医院可以立即应用抢救设备，治疗重症哮喘更安全。不应由于检查而延缓治疗，不应给予镇静药物，应警惕发生气胸。

给予药物治疗患者病情仍继续恶化，应立即给予正压通气。

急性重症哮喘的管理要点，参见急性重症哮喘管理规范。

2.2 慢性阻塞性肺疾病及其药物治疗

慢性阻塞性肺疾病（chronic obstructive pulmonary disease，COPD）是一种可以预防与治疗的疾病，伴有一些显著的肺外效应，这些肺外效应与疾病的严重性相关。肺部病变的特点为不完全可逆性气流受限，气流受限通常进行性发展，与肺部对有害颗粒或气体的异常炎症反应有关。临床上将 COPD 分为稳定期和急性加重期。

COPD 药物治疗目的包括预防和控制症状、减少急性加重频次和程度、改善健康状况和运动耐力等。目前治疗 COPD 的药物包括支气管舒张药、止咳祛痰药、抗菌药物、糖皮质激素、免疫调节剂等。

戒烟可减少 COPD 患者肺功能进行性下降，流感疫苗和肺炎球菌疫苗可预防 COPD 患者并发流感及肺炎球菌感染，适用于各严重级别的 COPD 患者。

吸入短效支气管舒张药，如 β_2 受体激动药及抗胆碱药对 I 期 COPD 患者减轻症状有益；中度（Ⅱ级）COPD 患者适用于规律应用一种或多种长效支气管舒张

药，如长效 $β_2$ 受体激动药或长效抗胆碱药，还可进行康复治疗；重度（Ⅲ级）患者，除可应用支气管舒张药等上述治疗外，可加用吸入糖皮质激素。极重度患者（Ⅳ级），常有慢性呼吸衰竭，在上述治疗基础上，应长期氧疗，必要时考虑外科治疗。长效 $β_2$ 受体激动药和吸入糖皮质激素联合或长效抗胆碱药多适用于重度 COPD 患者，前者比单用一种药物效果好。长期氧疗可延长严重 COPD 及低氧血症者生存率。

COPD 急性加重期，可吸入短效支气管舒张药以减轻呼吸困难症状，黏液溶解药及祛痰药有利于痰液咳出。重症患者短期应用全身性糖皮质激素（7 ~ 10 日）有益，但不推荐长期应用糖皮质激素治疗。对雾化吸入支气管舒张药效果不佳者，亦可试用氨茶碱静脉滴注。

免疫增强剂如在 COPD 急性加重季节前使用，有利于预防或减轻急性加重。

COPD 急性加重常由细菌感染诱发，抗菌药物治疗在 COPD 急性加重治疗中具有重要地位。当患者呼吸困难加重，咳嗽伴有痰量增多及脓性痰时，应根据 COPD 加重的严重程度及相应的细菌分层情况，结合该地区常见致病菌类型及耐药流行趋势和药物敏感情况尽早选择敏感的抗菌药物。应用抗菌药物时还需根据时间依赖性、浓度依赖性、抗生素后效应及血浆半衰期以决定给药剂量、间隔时间和疗程。

由于 COPD 患者以老年人为主，常伴随心脑血管疾病、糖尿病、肾功能不全等疾病。这不但影响治疗方案的制定，且影响疗效和不良反应的观察。肝肾功能障碍的患者要尽量避免使用对肝、肾有损害的药物。青光眼和前列腺增生者慎用抗胆碱药。

COPD 患者的年龄、性别、体重指数、营养状况等均与药物治疗有关。如老年人因为代谢缓慢，如果应用一些不良反应较大的药物，如茶碱、$β_2$ 受体激动药、万古霉素等，需根据患者年龄、性别、体重、肌酐清除率等计算给药剂量。此外，多种药物使用时，要注意药物相互作用。如在应用茶碱类药物同时应用大环内酯类或氟喹诺酮类等抗菌药物，会影响茶碱的清除率，使血浆茶碱浓度增高。

COPD 常见的并发症和伴发疾病有肺源性心脏病、心力衰竭、呼吸衰竭、气胸、酸碱失衡、心律失常、休克、上消化道出血、弥散性血管内凝血、肝肾功能不全、继发性红细胞增多症、肺栓塞、肺动脉原位血栓形成等。有关这些并发症治疗，将在有关章节介绍。

2.3 支气管舒张药

2.3.1 肾上腺素受体激动药

肾上腺素受体激动药（拟交感神经药）作为最主要的支气管扩张药在支气管哮喘及慢性阻塞性肺疾病（COPD）等慢性气道疾病的治疗中得到了广泛的应用。选择性 $β_2$ 受体激动药，如沙丁胺醇和特布他林对哮喘治疗是安全和有效的。选择性低的 $β_2$ 受体激动药，如肾上腺素应尽可能避免应用。

肾上腺素具有激动 α 和 β 肾上腺素受体的特性，可用于过敏反应紧急治疗。

2.3.1.1 选择性 $β_2$ 受体激动药

选择性 $β_2$ 受体激动药可产生支气管扩张作用，常按其作用时间进行分类。短效 $β_2$ 受体激动药用于迅速缓解症状，是目前按需使用的基本药物；长效 $β_2$ 受体激动药常和吸入糖皮质激素联合应用治疗需要长期治疗的患者。

2.3.1.1.1 短效 $β_2$ 受体激动药

轻中度哮喘对吸入短效 $β_2$ 受体激动药反应快速。如沙丁胺醇或特布他林。规则吸入短效 $β_2$ 受体激动药的效果比按需用药差，不适于作长期、单一使用。

在运动前即刻吸入短效 $β_2$ 受体激动药可减少运动诱发哮喘，但是频繁发生的运动性哮喘可能反映总的控制不佳，需要对哮喘治疗重新评估。

2.3.1.1.2 长效 $β_2$ 受体激动药

长效 $β_2$ 受体激动药，如福莫特罗和沙美特罗，是吸入性长效 $β_2$ 受体激动药，它们与吸入性糖皮质激素联合规则应用，可达到长程哮喘控制的作用，对夜间哮喘也有作用；沙美特罗因为起效比沙丁胺醇或特布他林慢，不应作为缓解哮喘急性发

作使用；福莫特罗起效的速度和沙丁胺醇相似，已注册可用于缓解短程症状和预防运动诱发支气管痉挛。

注意：长效 $β_2$ 受体激动药多和标准剂量糖皮质激素联合应用；不能初始用于快速恶化的急性哮喘发作；要低剂量应用，在治疗无益时应停用。

（1）吸入：压力型定量手控气雾剂是轻中度哮喘有效和方便的用药方法。储雾器装置可改善药物的给药效率。按推荐的吸入剂量，沙丁胺醇、特布他林的作用时间为 3 ～ 5 小时，沙美特罗和福莫特罗为 12 小时。必须向患者说清 $β_2$ 受体激动药 24 小时内吸入的剂量、频次和最大喷数。要告知患者如给予的 $β_2$ 受体激动药处方剂量达不到通常程度的症状缓解时应及时就医，因此，时常提示哮喘出现恶化，需要增加其他药物（如吸入性糖皮质激素）。

沙丁胺醇和特布他林的雾化器（或呼吸器）用溶液用来在医院或全科诊所中治疗严重急性哮喘症状。严重哮喘发作的患者雾化时最好给氧，因为 $β_2$ 受体激动药可以增加动脉低氧血症。在慢性阻塞性肺疾病中应用雾化治疗时，雾化器给予的剂量显著高于气雾剂剂量。因而应警示患者不应超过处方剂量，否则有危险。要告知他们在对通常剂量的呼吸器溶液无反应时需要就医。

无氟利昂气雾剂：压力定量气雾剂中的氟利昂（CFC）抛射剂正在被氢氟烷烃（HFA）不含氟的抛射剂（HFA）所取代。使用无氟利昂气雾剂的患者需重新确认新气雾剂的有效性，并被告知其气雾液可能使感觉和味道不同。对新气雾剂使用感到困难时需和医生或药剂师商量。

（2）口服：$β_2$ 受体激动药口服制剂可用于不能采用吸入途径的患者，常常用于儿童和老年人；但是吸入性 $β_2$ 受体激动药更有效、不良反应更少。长效口服制剂，包括班布特罗、丙卡特罗可用于夜间哮喘，但其作用有限，通常选用吸入型长效 $β_2$ 受体激动药。

（3）注射：危重型哮喘可静脉给予沙丁胺醇或特布他林。不推荐经皮下途径规则应用 $β_2$ 受体激动药，因为无确定的肯定有益的证据，而且一旦应用后，撤药就很困难。对严重发作患者给予 $β_2$ 受体激动药注射后，应让患者立刻去医院进行进一步诊治。$β_2$ 受体激动药也可通过肌内注射。

（4）儿童：即使对小于 18 个月的儿童，选择性 $β_2$ 受体激动药也有效果。吸入途径对大多数儿童有效，5 岁以下儿童可用储雾器连接压力定量气雾剂。$β_2$ 受体激动药也可口服给药，但最好是通过吸入方式；在适合的情况下也可应用长效 $β_2$ 受体激动药（需参考哮喘诊疗指南）。在严重发作时用 $β_2$ 受体激动药或异丙托溴铵雾化吸入也有效。

注意：在甲状腺功能亢进症、心血管疾病、心律失常、心电图 QT 间期延长和高血压者使用 $β_2$ 受体激动药时要慎用。妊娠时如需要高剂量，应通过吸入途径给药，因为 $β_2$ 受体激动药注射会影响子宫肌层，也可能影响心脏。糖尿病患者应用 $β_2$ 受体激动药也要注意，需对血糖进行监测（有酮症酸中毒危险，特别是静脉给予 $β_2$ 受体激动药）。

（5）低钾血症：$β_2$ 受体激动药治疗可引起严重的低钾血症。特别在危重型哮喘时，由于可能同时应用茶碱和其衍生物、糖皮质激素和利尿药治疗，以及低氧均可使低钾血症更明显。因此对危重型哮喘应监测血钾浓度。

（6）不良反应：$β_2$ 受体激动药的不良反应包括震颤、尤其是手震颤、神经紧张、头痛、肌肉痉挛和心悸。其他不良反应包括心律失常、外周血管扩张和睡眠及行为紊乱。反常支气管痉挛、荨麻疹、血管性水肿、低血压和虚脱也有报道。高剂量 $β_2$ 受体激动药可伴有低钾血症。

特布他林[保（乙）]

Terbutaline

【适应证】用于支气管哮喘，慢性支气管炎、肺气肿和其他伴有支气管痉挛的肺部疾病。

【注意事项】（1）对其他肾上腺素受体激动药过敏者，对本品也可能过敏。（2）本品对人或动物未见致畸作用，且可松弛子宫平滑肌，所以可抑制孕妇的子宫活动能力及分娩，应慎用。（3）下列情况

慎用，如甲状腺功能亢进症、冠心病、高血压、糖尿病、哺乳期妇女。(4) β_2 受体激动药可能会引起低钾血症，当与黄嘌呤衍生物、糖皮质激素、利尿药合用及氧都可能增加低钾血症的发生。因此，在这种情况下需监测血清钾浓度。(5) 大剂量应用可使有糖尿病史的患者发生酮症酸中毒。(6) 长期应用可产生耐受性，疗效降低。(7) 不良反应的程度取决于剂量和给药途径，从小剂量逐渐加至治疗量常能减少不良反应。

【禁忌证】对本品及其他肾上腺素受体激动药过敏者或处方中其他成分过敏者禁用。

【不良反应】震颤、头痛、恶心、强直性痉挛、心动过速、心悸；胃肠道障碍、皮疹和荨麻疹；睡眠失调和行为失调，如易激动、多动、坐立不安等；低钾血症。其他见前面“哮喘”内容。

【用法与用量】见前面“哮喘”内容。(1) 吸入：①气雾剂。一次 0.25～0.5 mg (1～2 揿)，一日 3～4 次，重病患者一次 1.5 mg (6 揿)，24 小时内的总量不应超过 6 mg (24 喷)。②雾化液。成人及 20 kg 以上儿童，一次 5 mg，一日 3 次。20 kg 以下的儿童，一次 2.5 mg，一日 3 次，不应超过 4 次。(2) 口服：①成人。开始 1～2 周，一次 1.25 mg，一日 2～3 次；以后可加至一次 2.5 mg，一日 3 次。②儿童。按体重一次 0.065 mg/kg (一次总量不应超过 1.25 mg)，一日 3 次。(3) 静脉注射：一次 0.25 mg，必要时 15～30 分钟 1 次，但 4 小时内用量不能超过 0.5 mg。

【制剂与规格】硫酸特布他林气雾剂：0.25 mg/ 揿，200 揿 / 瓶，或 400 揿 / 瓶。

硫酸特布他林雾化液：2 ml : 5.0 mg。

硫酸特布他林片：2.5 mg。

硫酸特布他林注射液：1 mg。

沙丁胺醇 [基 (基)，保 (甲)]

Salbutamol

【适应证】用于缓解支气管哮喘或喘息型支气管炎伴有支气管痉挛的病症。也用于其他肺疾病伴发的支气管痉挛。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全的患者需减量。(2) 下列情况慎用，如高血压、冠状动脉供血不足、心血管功能不全、糖尿病、甲状腺功能亢进症等，孕妇及哺乳期妇女。(3) 本品仅有支气管扩张作用，作用持续时间约 4 小时，不能过量使用，哮喘症状持续不能缓解者要及时就医。(4) 本品可能引起严重低钾血症，进而可能使洋地黄化者可造成心律失常。(5) 本品久用易产生耐受性，使药效降低。此时患者对肾上腺素等扩张支气管作用的药物也同样产生耐受性，使支气管痉挛不易缓解，哮喘加重。(6) 少数患者同时接受雾化沙丁胺醇及异丙托溴铵治疗时可能发生闭角型青光眼，故合用时不要让药液或雾化液进入眼中。

【禁忌证】对本品及其他肾上腺素受体激动药过敏者禁用。

【不良反应】常见肌肉震颤；亦可见恶心、心率加快或心律失常；偶见头晕、头痛、目眩、口舌发干、烦躁、高血压、失眠、呕吐、面部潮红、低钾血症等。

【用法与用量】见前面“哮喘”内容。(1) 吸入：①气雾剂。成人缓解症状，或运动及接触过敏原之前，一次 100～200 μg；长期治疗，最大剂量一次 200 μg，一日 4 次。儿童缓解症状或运动及接触过敏原之前 10～15 分钟给药，一次 100～200 μg；长期治疗，最大剂量一日 4 次，一次 200 μg。②溶液。成人一次 2.5 mg，用氯化钠注射液稀释到 2～2.5 ml，由驱动式喷雾器吸入。12 岁以下儿童的最小起始剂量为一次 2.5 mg，用氯化钠注射液 1.5～2 ml 稀释后，由驱动式喷雾器吸入。主要用来缓解急性发作症状。(2) 口服：成人，一次 2～4 片，一日 3 次。(3) 静脉滴注：一次 0.4 mg，用氯化钠注射液 100 mg 稀释后，每分钟 3～20 μg。

【制剂与规格】硫酸沙丁胺醇吸入气雾剂：100 μg/ 揿，200 揿 / 罐。

吸入用硫酸沙丁胺醇溶液：① 100 mg : 20 ml，② 50 mg : 10 ml。

硫酸沙丁胺醇片：2.4 mg (相当于沙丁胺醇 2 mg)。

硫酸沙丁胺醇注射液：2 ml : 0.4 mg。

班布特罗[保(乙)]

Bambuterol

【适应证】用于支气管哮喘，慢性喘息性支气管炎，慢性阻塞性肺疾病和其他伴有支气管痉挛的肺部疾病。

【注意事项】(1) 肝硬化、严重肝功能不全患者应个体化给予一日剂量。(2) 严重肾功能不全患者本品起始剂量应减少。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 甲状腺功能亢进症、糖尿病及心脏病患者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品、特布他林及拟交感胺类药物过敏者禁用。(2) 肥厚型心肌病患者禁用。

【不良反应】肌肉震颤、头痛、心悸、心动过速等；偶见强直性肌肉痉挛。

【用法与用量】口服：①成人。起始剂量为一次 10 mg，一日 1 次，睡前服用。根据临床疗效，1 ~ 2 周后剂量可调整为一次 20 mg，一日 1 次；肾功能不全患者（肾小球滤过率≤每分钟 50 ml）起始剂量为一次 5 mg，一日 1 次。②儿童。2 ~ 5 岁，一次 5 mg，一日 1 次；2 ~ 12 岁，一日最高剂量不超过 10mg。

【制剂与规格】盐酸班布特罗片：① 10 mg；② 20 mg。

丙卡特罗[保(乙)]

Procaterol

【适应证】适用于支气管哮喘、喘息性支气管炎、伴有支气管反应性增高的急性支气管炎、慢性阻塞性肺部疾病。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女、婴幼儿、老年人慎用。(2) 有下列情况慎用，如甲状腺功能亢进症、高血压、心脏病、糖尿病。(3) 有可能引起心律失常，服用时应予注意。

【禁忌证】对本品及肾上腺素受体激动药过敏者禁用。

【不良反应】偶见口干、鼻塞、倦怠、恶心、胃部不适、肌颤、头痛、眩晕或耳鸣；亦见皮疹、心律失常、心悸、面部潮红等。

【用法与用量】口服：①成人。一次 50 μg，一日 2 次，清晨及睡前服用；或一次 50 μg，一日 1 次，睡前服用。② 6 岁以上儿童，一次 25 μg，用法同成人。③儿童可依据年龄、症状和体重用量酌情增减。

【制剂与规格】盐酸丙卡特罗片：25 μg。

克仑特罗[保(乙)]

Clenbuterol

【适应证】用于支气管哮喘。

【注意事项】心脏病患者和甲状腺功能亢进症患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】少数患者服后感口干、心悸、手颤。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次 20 ~ 40 μg，一日 3 次。②儿童，一次 5 ~ 20 μg，一日 3 次。(2) 吸入：一次 10 ~ 20 μg，一日 3 次。(3) 直肠给药：一次 60 μg，每晚睡前 1 次。

【制剂与规格】盐酸克仑特罗片：① 20 μg；② 40 μg。

盐酸克仑特罗气雾剂：2 mg。

盐酸克仑特罗栓剂：60 μg。

福莫特罗[保(乙)]

Formoterol

【适应证】用于治疗支气管哮喘，慢性支气管炎，喘息性支气管炎、肺气肿引起的呼吸困难。尤其适用于夜间发作型的哮喘患者和需要长期服用 β_2 受体激动药的患者。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全、严重肝硬化患者慎用。(2) 下列情况慎用，如甲状腺功能亢进症、嗜铬细胞瘤、梗阻性肥厚型心肌病、严重高血压、颈内动脉－后交通动脉瘤、或其他严重的心血管病（如心肌缺血、心动过速或严重心衰）、孕妇及哺乳期妇女、运动员。(3) 可能造成低钾血症。哮喘急性发作时，应更加注意。联合用药也可能增加血钾降低的作用。因此在上述情况下，建议监测血钾浓度。(4) 本品能引起 QTc 间期延长，因此伴有 QTc 间期延长的患者及使用影响 QTc 间期的药物治疗的患者应慎用。(5) 可影响血糖代谢，糖尿病患者用药初期应注意血糖的控制。(6) 本品可能引起气道痉挛。哮喘急性发作时的缺氧会增加此危险性。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见头痛、心悸、震颤；偶见烦躁不安、失眠、肌肉痉挛、心动过速；罕见皮疹、荨麻疹、房颤、室上性心动过速、期前收缩、支气管痉挛、低钾血症或高钾血症。个别病例有恶心、味觉异常、眩晕、心绞痛、心电图 QTc 间期延长、过敏反应、血压波动和血中胰岛素、游离脂肪酸、血糖、尿酮体水平升高。

【用法与用量】吸入：成人常用量为一次 4.5 ~ 9 μg，一日 1 ~ 2 次，早晨和晚间用药；或一次 9 ~ 18 μg，一日 1 ~ 2 次，一日最高剂量 36 μg。哮喘夜间发作，可于晚间给药 1 次。

【制剂与规格】富马酸福莫特罗干粉吸入剂：①每吸 4.5 μg，60 吸／支；②每吸 9 μg，60 吸／支。

沙美特罗[保（乙）]

Salmeterol

【适应证】用于支气管哮喘，包括夜间哮喘和运动引起的支气管痉挛的防治；与吸入糖皮质激素合用，用于可逆性阻塞性气道疾病，包括哮喘，慢性阻塞性肺疾病。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肺结核、甲状腺功能亢进症、对拟交感胺类有异常反应、有低钾血症倾向、已患有心血管疾病、有糖尿病史、孕妇及哺乳期妇女。(2) 本品不适用于缓解急性哮喘发作。(3) 治疗可逆性阻塞性气道疾病应常规遵循阶梯方案，并应通过观察临床症状及测定肺功能来监测患者对治疗的反应。为避免哮喘急性加重的风险，不可突然中断使用本品治疗。

【禁忌证】对本品过敏者，对牛奶过敏的患者禁用。

【不良反应】可见震颤、心悸及头痛等。偶见心律失常、肌痛、肌肉痉挛、水肿、血管神经性水肿；罕见口咽部刺激。

【用法与用量】(1) 粉雾剂胶囊：粉雾吸入，成人一次 50 μg，一日 2 次；儿童一次 1 吸 25 μg，一日 2 次。(2) 气雾剂：雾吸入，量用法同粉雾吸入。(3) 沙美特罗替卡松粉吸入剂：①成人和 12 岁及 12 岁以上的青少年，根据病情选择三种规格中的任何一种，一次 1 吸，一日 2 次。② 4 岁及 4 岁以上的儿童，50 μg/100 μg（沙美特罗／丙酸氟替卡松），一次 1 吸，一日 2 次。本品可逐渐减量至一日 1 次。

【制剂与规格】沙美特罗粉雾剂胶囊：50 μg。

沙美特罗气雾剂：每喷 25 μg（60 喷、120 喷、200 喷）。

沙美特罗氟替卡松干粉吸入剂：每喷含沙美特罗 50 μg，丙酸氟替卡松 100 μg（60 喷）；或沙美特罗 50 μg，丙酸氟替卡松 250 μg（60 喷）。

2.3.1.2 其他肾上腺素受体激动药

异丙肾上腺素[基（基），保（甲）]

Isoprenaline

【适应证】用于支气管哮喘。

【注意事项】(1) 对其他肾上腺能激动药过敏者，对本品也可能过敏。(2) 妊娠期及哺乳期妇女应用时必须权衡利弊。(3) 下列情况慎用，如心律失常并伴有心动过速、心血管疾病（包括心绞痛，冠状动脉供血不足）、糖尿病、高血压、洋地黄中毒所致心动过速。(4) 遇有胸痛及心律失常应及早用药。(5) 舌下给药时不得嚼碎，否则不能速效。(6) 12 小时内已雾化吸入药物 3 ~ 5 次而疗效不显著者应停药就医。(7) 与肾上腺素交替使用时，需待前者作用消失后才可用后者。

【禁忌证】对本品过敏者；心绞痛、心肌梗死、甲状腺功能亢进症、嗜铬细胞瘤患者。

【不良反应】常见口咽发干、心悸不安。少见头晕、目眩、面部潮红、恶心、心率增速、震颤、多汗、乏力等。

【用法与用量】(1) 气雾吸入：成人，一次 0.175 ~ 0.35 mg，一日 2 ~ 4 次，喷吸间隔时间不得少于 2 小时。(2) 舌下含服：①成人，一次 10 ~ 15 mg，一日 3 次。②儿童，一次 2.5 ~ 10 mg，一日 3 次。极量，舌下给药一次 20 mg，一日 60 mg。(3) 复方异丙托溴铵气雾剂：成人（包括老年人），一次 2 揿，一日 4 次。需要时可用至最大剂量，即 24 小时内 12 揿。(4) 吸入用复方异丙托溴铵溶液：用

于成人和12岁以上的青少年；急性发作期一次1～2支；维持治疗期一次1支，一日3～4次。

【制剂与规格】盐酸异丙肾上腺素片：10 mg。

盐酸异丙肾上腺素气雾剂：0.25%，200揿/瓶，0.175 mg/揿。

复方异丙托溴铵气雾剂：10 ml/瓶，每瓶200揿；每瓶含异丙托溴铵一水合物4.2 mg和硫酸沙丁胺醇24 mg，每揿含异丙托溴铵一水合物21 μg和硫酸沙丁胺醇120 μg。

吸入用复方异丙托溴铵溶液：2.5 ml/支，内含异丙托溴铵一水合物0.522 mg，和硫酸沙丁胺醇3 mg。

氯丙那林[保(乙)]

Clorprenaline

【适应证】用于支气管哮喘，具有喘息症状的支气管炎。

【注意事项】下列情况慎用，如心律失常、高血压、甲状腺功能亢进症、糖尿病及前列腺增生而致排尿困难。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】可见头痛、心悸、恶心、胃部不适、手指颤动等。

【用法与用量】口服：成人一次5～10 mg，一日3次。预防夜间哮喘发作，可在临睡前加服5～10 mg。

【制剂与规格】盐酸氯丙那林片：5 mg。

麻黄碱[基(基)]

Ephedrine

【适应证】用于咳嗽、咳痰，也可用于喘息性支气管炎及单纯性支气管炎引起的咳嗽和哮喘。滴鼻用于缓解鼻黏膜充血肿胀引起的鼻塞。

【注意事项】(1) 休克患者于应用前宜尽量纠正血容量不足，缺氧、二氧化碳潴留、酸中毒时本品作用降低，发生不良反应的概率增加。(2) 短期反复应用可致快速耐受现象，药理作用减弱，停药数小时后可以恢复。(3) 用药过量可表现为中枢神经系统兴奋、心律失常、心率加快、失眠或惊厥。对惊厥者静脉注射苯巴比妥钠，对心律失常者可静脉注射硫酸镁，对失眠者可口服苯巴比妥或司可巴比妥。(4) 萎缩性鼻炎患者、妊娠及哺乳妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。甲状腺功能亢进、高血压、动脉硬化、心绞痛、心律失常患者禁用。闭角型青光眼、精神病、糖尿病、前列腺增生患者禁用。

【不良反应】常见心悸、头痛、高血压、室性心律失常、烦躁、焦虑、激动、失眠、兴奋、激动；少见有口渴、恶心、呕吐、肌肉无力、蛋白尿、排尿困难；大剂量长期应用可出现震颤、发热、出汗等。

【用法与用量】(1) 口服：一次25 mg，一日3次。(2) 肌内注射或皮下注射：用于预防哮喘发作和休克，一次15～30 mg，一日2～3次，一日总量45～60 mg。(3) 静脉注射：一次25 mg，必要时间隔5～10分钟再给予25 mg，24小时内总量为150 mg。

【制剂与规格】麻黄碱片：25 mg。

盐酸麻黄碱注射液：1 ml : 30 mg。

盐酸麻黄碱（呋麻）滴鼻剂：8 ml : 80 mg。

2.3.2 抗胆碱支气管舒张药

异丙托溴铵对于慢性持续期哮喘，可短期缓解症状，但与短效 β_2 受体激动药相比，后者因起效更快而作为首选。对于威胁生命的哮喘，或标准治疗无效的急性哮喘，异丙托溴铵雾化溶液可用于其他标准治疗中。

轻度慢性阻塞性肺疾病患者，如未使用长效抗胆碱药，异丙托溴铵气雾剂可用于短期缓解症状。其最大效应发生于给药后30～60分钟，作用持续3～6小时，一日给药3次通常能保持支气管舒张。

噻托溴铵，为长效抗胆碱支气管舒张药，能有效治疗慢性阻塞性肺疾病，该药不适用于缓解急性支气管痉挛。

注意：抗胆碱支气管舒张药慎用于前列腺增生、膀胱流出道梗阻患者，慎用于急性闭角型青光眼易感者。

有报道雾化吸入异丙托溴铵发生急性闭角型青光眼，尤其与沙丁胺醇雾化溶液合用时（亦可能是其他 β_2 受体激动药）易发生；需注意保护防止雾化液和药粉接

触患者的眼睛。

不良反应：常见口干；少见恶心和头痛；罕见便秘、心动过速、心悸、矛盾性支气管痉挛、尿潴留、视物模糊、闭角型青光眼和过敏反应（包括皮疹、荨麻疹和血管性水肿）。

异丙托溴铵[保(乙)]

Ipratropine Bromide

【适应证】用于慢性阻塞性肺疾病相关的支气管痉挛，包括慢性支气管炎、肺气肿哮喘等，可缓解喘息症状。

【注意事项】(1) 使用本品后可能会立即发生变态反应。(2) 下列情况慎用，如闭角型青光眼倾向的患者或有前列腺肥大或膀胱颈梗阻等症状患者，孕妇及哺乳期妇女。(3) 应避免使眼睛接触到本品，如果在使用中不慎污染到眼睛，引起眼睛疼痛或不适、视物模糊、结膜充血和角膜水肿并视物有光晕或有色成像等闭角型青光眼的征象，应首先使用缩瞳药并立即就医。(4) 患有囊性纤维化的患者可能会引起胃肠道蠕动的紊乱。(5) 有尿道梗阻的患者使用时尿潴留危险性增高。

【禁忌证】(1) 对阿托品及其衍生物过敏患者禁用。(2) 对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见头痛、恶心和口干；少见心动过速、心悸、眼部调节障碍、胃肠动力障碍和尿潴留等抗胆碱能不良反应；可能引起咳嗽、局部刺激；罕见吸入刺激产生的支气管痉挛，变态反应如皮疹、舌、唇和面部血管性水肿、荨麻疹、喉头水肿和过敏反应。

【用法与用量】吸入：(1) 溶液。成人（包括老人）和 12 岁以上青少年，一次一个单剂量小瓶（500 μg），一日 3 ~ 4 次，急性发作的患者病情稳定前可重复给药。单剂量小瓶中每 1 ml 雾化吸入液可用氯化钠注射液稀释至终体积 2 ~ 4 ml。(2) 气雾剂。成人及学龄儿童推荐剂量，一次 40 ~ 80 μg，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】吸入用异丙托溴铵溶液：① 2 ml：50 μg；② 2 ml：250 μg；③ 2 ml：500 μg；④ 20 ml：500 μg。

异丙托溴铵气雾剂：① 20 μg/揿，200 揿／支；② 40 μg/揿，200 揿／支。

复方异丙托溴铵气雾剂：每瓶 14 g (10 ml)，含异丙托溴铵（以无水物计）4 mg、硫酸沙丁胺醇 24 mg，每揿含异丙托溴铵（以无水物计）20 μg、硫酸沙丁胺醇 120 μg。每瓶总揿次为 200 喷。用于预防和治疗支气管哮喘或喘息型支气管炎等伴有支气管痉挛（喘鸣），慢性阻塞性肺疾病的平喘治疗的呼吸道疾病。一般作为临时用药，有哮喘发作预兆或哮喘发作时，气雾吸入。每次吸入 0.1 ~ 0.2 mg，即 1 ~ 2 喷，必要时可每隔 4 ~ 8 小时吸入一次，但 24 小时内最多不宜超过 8 喷。

噻托溴铵[保(乙)]

Tiotropium Bromide

【适应证】用于慢性阻塞性肺部疾病的维持治疗，包括慢性支气管炎和肺气肿、伴随性呼吸困难的维持治疗及急性发作的预防。

【注意事项】(1) 吸入噻托溴铵粉末后有可能立即发生变态反应。(2) 下列情况慎用，如闭角型青光眼、前列腺增生、膀胱颈梗阻、中重度肾功能不全、18 岁的患者、孕妇及哺乳期妇女。(3) 如药粉误入眼内可能引起或加重闭角型青光眼症状，应立即停用并就医。(4) 本品使用不得超过一日一次。

【禁忌证】对噻托溴铵、阿托品或其衍生物过敏的患者。

【不良反应】常见口干、便秘、念珠菌感染、鼻窦炎、咽炎；少见全身过敏反应、心动过速、房颤、心悸、排尿困难、尿潴留。有发生恶心、声音嘶哑、头晕、血管性水肿、皮疹、荨麻疹、皮肤瘙痒；因吸入刺激导致的支气管痉挛，还可能有视物模糊、青光眼。

【用法与用量】吸入：一次 18 μg，一日 1 次。

【制剂与规格】噻托溴铵粉吸入剂（胶囊）：18 μg。

2.3.3 茶碱类支气管舒张药

茶碱是一种支气管舒张药，通常用于支气管哮喘和稳定期慢性阻塞性肺疾病（COPD）的治疗，对 COPD 急性加重的疗效不显着。茶碱的药理作用表现为：

(1) 松弛支气管平滑肌，也能松弛肠道、胆道等多种平滑肌。对支气管黏膜的充血、水肿有缓解作用。(2) 增加心排血量，扩张入球和出球肾小动脉，增加肾小球滤过率和肾血流量，抑制肾小管重吸收钠离子和氯离子，具有利尿作用。(3) 可改善COPD患者膈肌收缩力，减少呼吸肌疲劳。临床上茶碱虽然被列为支气管扩张药，但实际上其支气管扩张效应较弱，茶碱对于气流受限性疾病的治疗作用，可能主要是通过茶碱的非支气管扩张效应。

茶碱在肝脏内代谢，茶碱的血浆浓度变异较大，尤其是在吸烟人群、肝功能损伤以及心力衰竭的患者中。在心力衰竭、肝硬化、病毒感染、老年人和服用抑制茶碱代谢的药物时，茶碱的血浆浓度可增加。吸烟、慢性乙醇中毒和诱导肝代谢药物可降低茶碱血浆浓度。

由于茶碱的中毒剂量与其治疗剂量相当接近，茶碱的半衰期的差异很重要；尤其当引入或撤出与茶碱药物相互作用的药物时，需要特别小心。在大部分人群中，茶碱血浆浓度为10～20 mg/L，可获满意的支气管舒张效应。当然，茶碱血浆浓度为10 mg/L（或＜10 mg/L），可能也有治疗作用。茶碱浓度为10～20 mg/L时，也可能发生不良反应。但如浓度高于20 mg/L，则茶碱不良反应发生的频率和程度明显增加。近来的研究结果提示，5～10 mg/L的茶碱低血药浓度也可收到较好疗效，故茶碱用量有减少的趋势。

茶碱的注射剂型为氨茶碱，是茶碱和乙烯双胺（Ethylenediamine）的复合物，其溶解度比茶碱高20倍。氨茶碱很少用于哮喘重度发作。必须非常缓慢的静脉注射（至少超过20分钟）；氨茶碱肌内注射刺激性大。测定茶碱血药浓度相当有益，尤其对于已经服用氨茶碱治疗的患者，当需要再注射氨茶碱治疗时，必须测定，因为氨茶碱严重的不良反应，如惊厥和心律失常，可以先于其他不良反应的发生。

茶碱 [基(基)，保(甲)]

Theophylline

【适应证】用于缓解成人和3岁以上儿童的支气管哮喘的发作。用于哮喘急性发作后的维持治疗。也用于缓解阻塞性肺疾病伴有的支气管痉挛的症状。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全的患者，应酌情调整用药剂量或延长给药间隔。(2) 下列情况慎用，如有消化性溃疡、任何原因引起的心力衰竭、持续高热、低氧血症、高血压、孕妇及哺乳妇女、新生儿、老年人。(3) 本品的缓释制剂不可咀嚼服用。本品不适用于哮喘持续状态或急性支气管痉挛发作的患者。(4) 可致心律失常和使原有的心律失常恶化。(5) 应定期监测血清茶碱浓度，以保证最大的疗效而不发生血药浓度过高的危险。(6) 吸烟者茶碱的肝代谢加强，需增加用药剂量。(7) 茶碱可致心律失常，或使原有的心律失常恶化，应加强监测。

【禁忌证】对茶碱不能耐受的患者禁用；未治愈的潜在癫痫患者；严重心功能不全患者及急性心肌梗死伴有血压降低者禁用。

【不良反应】常见头痛、恶心、呕吐和失眠；少见消化不良、震颤和眩晕。血药浓度较高时可见发热、失水、惊厥等，严重者甚至呼吸心搏停止。

【用法与用量】口服：①片剂。成人一次0.1～0.2 g，一日3次。极量一次0.3 g，一日1 g。②控释胶囊。成人一次0.2 g，一日1～2次，最大剂量一日0.6 g。③缓释片。成人一次0.2～0.4 g，一日1次，晚间服。3岁以上儿童可以按0.1 g开始治疗，一日最大剂量不应超过10 mg/kg。

【制剂与规格】茶碱片：0.1 g。

茶碱缓释片：① 0.1 g；② 0.4 g。

茶碱缓释胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g；③ 0.3 g。

茶碱控释片：0.1 g。

茶碱控释胶囊：① 0.1 g；② 0.3 g。

复方茶碱片：每片含茶碱25 mg。口服：一日2～3次，一次1片。

氨茶碱 [基(基)，保(甲)]

Aminophylline

【适应证】用于支气管哮喘、喘息性支气管炎、慢性阻塞性肺疾病，也可用于急性心功能不全和心源性哮喘。

【注意事项】(1) 肾功能或肝功能不全的患者，应酌情调整用药剂量或延长给药间隔。(2) 下列情况慎用，如高血压、非活动性消化道溃疡病史患者、孕妇及哺乳期妇女、新生儿、老年人。(3) 茶碱制剂可致心律失常和（或）使原有的心律失常恶化；患者心率和（或）节律的任何改变均应进行监测和研究。(4) 应定期监测血清茶碱浓度，以保证最大的疗效而不发生血药浓度过高的危险。

【禁忌证】对本品过敏的患者、活动性消化道溃疡和未经控制的惊厥性疾病。

【不良反应】恶心、呕吐、易激动、失眠；心动过速、心律失常；发热、失水、惊厥甚至呼吸、心搏骤停致死。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次 0.1～0.2 g，一日 3 次；极量一次 0.5 g，一日 1 g。②儿童，按体重一日 3～5 mg/kg，分 2～3 次服。(2) 静脉注射：①成人，一次 0.125～0.25 g，用 20～40 ml 50%葡萄糖注射液稀释后，缓慢静脉注射，注射时间不得短于 10 分钟，极量一次 0.5 g，一日 1 g。②儿童按体重一次 2～4 mg/kg。(3) 静脉滴注：一次 0.25～0.5 g，用葡萄糖注射液 250 ml 稀释后缓慢滴注。

【制剂与规格】氨茶碱片：① 100 mg；② 200 mg。

氨茶碱注射液：① 2 ml：250 mg；② 2 ml：500 mg。

复方甲氧那明胶囊：每粒含盐酸甲氧那明 12.5 mg，那可丁 7 mg，氨茶碱 25 mg，马来酸氯苯那敏 2 mg。用于支气管哮喘和喘息性支气管炎。成人一次 2 粒，一日 3 次，饭后服用。15 岁以上，一次 2 粒，一日 3 次。8～15 岁，一次 1 粒，一日 3 次。

二羟丙茶碱[保(乙)]

Diprophylline

【适应证】用于支气管哮喘、具有喘息症状的支气管炎、慢性阻塞性肺疾病等缓解喘息症状。也用于心源性肺水肿引起喘息。尤适用于不能耐受茶碱的哮喘病例。

【注意事项】(1) 高血压、有消化道溃疡病史者、老年人、孕妇、哺乳期妇女及新生儿慎用本品。(2) 大剂量可致中枢神经兴奋，预服镇静药可防止。(3) 哮喘急性严重发作的患者不首选本品。(4) 茶碱类药物可致心律失常和（或）使原有的心律失常恶化，患者心率和（或）心律的任何改变均应密切注意。

【禁忌证】对本品过敏，活动性消化道溃疡和未经控制的惊厥性疾病。

【不良反应】类似茶碱。剂量过大时可出现恶心、呕吐、易激动、失眠、心动过速、心律失常，可见发热、脱水、惊厥等症状，严重者甚至呼吸、心搏骤停。

【用法与用量】(1) 口服：成人，一次 0.1～0.2 g，一日 3 次；极量一次 0.5 g。(2) 静脉滴注：一次 0.25～0.75 g，以 5%或 10%葡萄糖注射液 250～500 ml 稀释后静脉滴注，滴注时间 1～2 小时。(3) 静脉注射：一次 0.5～0.75 g，用 25%葡萄糖注射液 20～40 ml 稀释后缓慢注射，注射时间 15～20 分钟。

【制剂与规格】二羟丙茶碱片：① 100 mg；② 200 mg。

二羟丙茶碱注射液：2 ml：250 mg。

多索茶碱[保(乙)]

Doxofylline

【适应证】用于支气管哮喘、具有喘息症状的支气管炎及其他支气管痉挛引起的呼吸困难。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如严重心、肺功能异常者，甲状腺功能亢进症，及活动性胃、十二指肠溃疡等症，肾功能不全、肝功能不全，孕妇及哺乳期妇女。(2) 本品剂量要视个体病情变化选择最佳剂量和用药方法。必要时检测血药浓度。(3) 本品不得与其他黄嘌呤类药同时服用。(4) 服药期间不要饮用含咖啡因的饮料或食品。

【禁忌证】凡对本品或黄嘌呤衍生物类药物过敏者、急性心肌梗死患者。

【不良反应】少见心悸、窦性心动过速、上腹不适、食欲缺乏、恶心、呕吐、兴奋、失眠。如过量服用可出现严重心律失常、阵发性痉挛。

【用法与用量】口服：成人，一次 0.2～0.4 g，一日 2 次，餐前或餐后 3 小时服用。

【制剂与规格】多索茶碱片：① 200 mg；② 300 mg。

2.4 糖皮质激素

糖皮质激素常被用来治疗可逆性和不可逆性气道炎性疾病，吸入糖皮质激素 3 ~ 4 周有助于鉴别支气管哮喘和慢性阻塞性肺疾病，应用 3 ~ 4 周后症状明显改善者提示哮喘的可能。

不含氯氟烷烃（CFC）的与含氯氟烷烃的糖皮质激素吸入器的吸入剂量可能不同。

加压气溶胶吸入器的含 CFC 抛射剂正在被氢氟烷烃（HFA）抛射剂所代替。当患者应用不含 CFC 吸入器时应保证新式吸入器的有效性并且告知他们应用新型吸入器会使气溶胶的感觉和味觉与以前不同。如遇到问题应咨询医师或药剂师。

如果吸入的糖皮质激素导致咳嗽，预先应用 β_2 受体激动药可能会缓解。

哮喘：糖皮质激素控制哮喘很有效，能减轻气道炎症反应（减轻气道水肿和黏液的分泌）。

吸入糖皮质激素多在以下情况应用：哮喘轻度持续以上（第 2 级以上）患者（见哮喘分级）；患者近两年有急性加重必须以全身糖皮质激素或一种吸入型支气管扩张药治疗时（见于哮喘分级和长期治疗方案）。规律吸入糖皮质激素可降低哮喘恶化的风险。

吸入糖皮质激素必须规律使用以产生最大的效益。通常在使用 3 ~ 7 日后症状减轻。

二丙酸倍氯米松（二丙酸氯地米松），布地奈德，丙酸氟替卡松，和糠酸莫米松疗效相当。糖皮质激素加长效 β_2 受体激动药的复合制剂与以同样的两种药物分别使用比较，前者可能更有益。

长期口服糖皮质激素的患者可转换为吸入糖皮质激素，但是转换必须缓慢。在哮喘得到良好控制的同时逐渐减少口服糖皮质激素的剂量，再过渡为吸入糖皮质激素。

当吸入标准剂量的糖皮质激素和长效 β_2 受体激动药或其他长效支气管扩张药治疗时，如患者仅获部分疗效时，建议加大吸入糖皮质激素剂量。只有在吸入大剂量糖皮质激素的效果明显好于较低剂量时才可持续应用。一般不要超过推荐的吸入糖皮质激素的最大剂量。但是，如果需要使用更大的剂量（例如氟替卡松成人使用量超过一次 500 μg，一日 2 次，或 4 ~ 16 岁儿童使用量超过一次 200 μg，一日 2 次），应在医师指导下应用。应用大剂量的吸入性糖皮质激素可减少口服糖皮质激素的剂量。

在患者发生感染或哮喘急性加重时，往往需要更大剂量的糖皮质激素，但吸入的药物到达小气道的量可能会减少，因此患者需要口服糖皮质激素以增加疗效。

（1）慢性阻塞性肺疾病：慢性阻塞性肺疾病吸入糖皮质激素治疗可能会减少急性加重。当第 1 秒用力呼气量（FEV_1）占预计值的比例 < 50%，且一年中有 2 次或 2 次以上的病情加重而需要抗生素时，除已有支气管扩张药治疗外，应考虑予以吸入糖皮质激素治疗。

注意：在伴有活动期或静止期结核时，吸入糖皮质激素要谨慎；在应激阶段、有气道阻塞或有黏液阻碍药物进入小气道时，可以全身应用糖皮质激素。

（2）反常性支气管痉挛：应牢记吸入糖皮质激素可能会出现矛盾性支气管痉挛（paradoxical bronchospasm），此时需要停药和替换治疗。对于轻度支气管痉挛，吸入短效 β_2 受体激动药、或者将气雾吸入剂改为干粉吸入剂可缓解。

（3）不良反应：普遍认为吸入性糖皮质激素较口服或静脉注射糖皮质激素的全身不良反应少，但也有不良反应的报道。

长期吸入较大剂量的糖皮质激素有引起肾上腺功能抑制的潜在危险，应用大剂量糖皮质激素的患者应有一张“皮质糖皮质激素卡”；当这些患者在应激状态下（例如手术）可能需要补充糖皮质激素治疗。儿童吸入糖皮质激素与发生肾上腺危象和昏迷相关联，故应避免超剂量使用，一般氟替卡松常规剂量为 50 ~ 100 μg，一日 2 次，不能超过 200 μg，一日 2 次。

在老年慢性阻塞性肺疾病患者，大剂量的吸入糖皮质激素也与下呼吸道感染有

关，包括肺炎。

随着长期吸入较大剂量的糖皮质激素，骨矿物质密度会降低，导致患者骨质疏松。因此尽量使用能够保证患者的哮喘得到良好控制的最低剂量。在哮喘轻度发作病情控制后，吸入糖皮质激素治疗通常可以停止，但患者要知道在哮喘再次加重或峰流速下降时应恢复使用糖皮质激素。

儿童生长迟缓与口服糖皮质激素治疗相关，但在应用推荐吸入剂量的糖皮质激素时生长受抑现象并不明显；虽然初始的生长速度可能延缓，但并不影响其到达正常成人身高。但是，仍建议对接受长期吸入糖皮质激素治疗的儿童要监测身高，当出现生长缓慢时，要考虑就诊于儿科医师。5岁以下儿童吸入糖皮质激素时应使用大容积储雾罐装置，但对于年龄大一些的儿童和成人同样也适用，特别当需要较大药物剂量时。储雾罐装置在提高药物气道沉积的同时可减少口咽部的沉积。

有报道称长时间大剂量吸入糖皮质激素会轻度增加青光眼的危险；也有白内障与吸入糖皮质激素相关的报道。通常只有大剂量吸入糖皮质激素时才会出现声嘶和口咽部念珠菌感染(见下文)。过敏反应(包括皮疹和血管性水肿）罕有报道。其他少见的不良反应包括矛盾性支气管痉挛、焦虑症、抑郁症、睡眠紊乱以及行为方面的改变，如亢奋及易激惹等。

念珠菌病：吸入糖皮质激素伴发的口腔念珠菌病可通过应用储雾罐来减少其发生（见上述)，在没有终止糖皮质激素治疗的情况下可应用抗真菌药，在吸入糖皮质激素后漱口（儿童可清洗牙齿）对预防真菌感染有帮助。

口服：哮喘急性加重期应考虑短程口服糖皮质激素治疗，开始时剂量可较大，例如泼尼松龙一日 40 ~ 50 mg 持续 1 周。糖皮质激素对于急性加重的哮喘患者通常很快起效。轻度加重的哮喘在症状控制后通常可快速停药（见糖皮质激素的停药），但对于哮喘控制不满意的患者，糖皮质激素要逐步减量，以免引起严重的复发。

对于慢性持续期哮喘，当其他药物不能很好地控制时，给予长期的口服糖皮质激素治疗可能是必要的；如可能应尽量替换为大剂量吸入糖皮质激素，这样可以减少口服糖皮质激素的不良反应。对于慢性阻塞性肺疾病可予泼尼松龙一日 30 mg，7 ~ 14 日，并可以随时停药。延长泼尼松龙的给药时间并没有益处，一般不推荐维持治疗。

口服糖皮质激素通常应清晨顿服以减少对生理性皮质醇分泌的影响，用药剂量应该始终被保持在控制症状的最低剂量。常规峰流速（呼吸）测量有助于较好的调整剂量。

注射给药：氢化可的松注射剂在急性重症哮喘的急救治疗中的应用见急性重症哮喘表，急性重症哮喘的治疗在综合处理章节予以介绍。

倍氯米松[保(乙)]

Beclomethasone

【适应证】用于慢性支气管哮喘。

【注意事项】(1) 过敏性鼻炎等过敏反应，可使用抗组胺药物或局部用制剂(包括局部使用的糖皮质激素）进行治疗。(2) 下列情况慎用，如患有活动期和静止期的肺结核，孕妇及哺乳期妇女。(3) 对于长期使用糖皮质激素的儿童和青少年，应密切随访其生长状况。(4) 从口服糖皮质激素转为吸入糖皮质激素时，在很长时间内肾上腺储备功能受损的风险仍然存在。定期监测肾上腺皮质功能。(5) 对可逆性阻塞性气道疾病（包括哮喘）的处理应常规遵循阶梯方案，并应由临床症状及通过肺功能测定监测患者的反应。(6) 本品不用于缓解急性哮喘症状，如需要时，急性哮喘症状应使用快速短效的支气管扩张药（如沙丁胺醇)。(7) 在急救或易导致应激的选择情况下，应考虑采用适当的皮质糖皮质激素治疗。(8) 本品不适用于患有重度哮喘的患者；不用于哮喘的初始治疗；应个体化用药。(9) 不可突然中断治疗。(10) 每次用药后用水漱口。

【禁忌证】对本品过敏或本品中其他附加成分过敏。

【不良反应】常见口腔及喉部的念珠菌病、声嘶，喉部刺激；偶见免疫系统失调，如皮疹、风疹、瘙痒症及红斑；罕见异常支气管痉挛，眼、睑部、嘴唇和喉部

的水肿，呼吸困难和支气管痉挛和过敏反应、白内障、青光眼，库欣综合征、肾上腺抑制、儿童和青少年生长发育迟缓、骨矿物质密度减少等内分泌失调，以及焦虑、睡眠紊乱、行为改变，包括活动过度、易激怒（主要见于儿童）等精神失调。

【用法与用量】吸入：①成人及12岁以上儿童。轻微哮喘，一日200～400μg或以上，分2～4次用药；中度哮喘，一日600～1200μg，分2～4次用药；严重哮喘，一日1000～2000μg，分2～4次用药。②5～12岁儿童。一日200～1000μg；4岁以下儿童，一日总剂量100～400μg，分次用药。

【制剂与规格】丙酸倍氯米松气雾剂：每揿含丙酸倍氯米松50μg或250μg。

丙酸倍氯米松粉吸入剂：每吸含丙酸倍氯米松50μg、100μg或200μg。

布地奈德[保（乙）]

Budesonide

【适应证】支气管哮喘，主要用于慢性持续期支气管哮喘；也可在重度慢性阻塞性肺疾病使用。

【注意事项】(1) 鼻炎、湿疹等过敏性疾病，可使用抗组胺药及局部制剂进行治疗。(2) 下列情况慎用，如肺结核、鼻部真菌感染和疱疹、孕妇及哺乳期妇女。(3) 长期接受吸入治疗的儿童应定期测量身高。2岁以下儿童应慎用或不用。(4) 由口服糖皮质激素转为吸入布地奈德或长期高剂量治疗的患者应特别小心，可能在一段时间内处于肾上腺皮质功能不全的状况中。建议进行血液学和肾上腺皮质功能的监测。(5) 不适用于快速缓解支气管痉挛。(6) 在哮喘加重或严重发作期间，或在应激择期手术期间应给予全身性糖皮质激素。(7) 应避免合用酮康唑、伊曲康唑或其他强CYP3A4抑制药。若必须合用上述药物，则用药间隔时间应尽可能长。(8) 每次用药后用水漱口。

【禁忌证】对本品过敏者，2岁以下儿童。

【不良反应】轻度喉部刺激、舌部和口腔刺激，咳嗽、口干、溃疡、声嘶、咽部疼痛不适；味觉减弱；口咽部念珠菌感染；头痛、头晕；恶心、腹泻、体重增加、疲劳；速发或迟发的过敏反应，包括皮疹、接触性皮炎、荨麻疹、血管性水肿和支气管痉挛；精神症状，包括紧张、不安、抑郁和行为障碍等；罕见皮肤淤血、肾上腺功能减退和生长缓慢。

【用法与用量】吸入：(1) 气雾剂，严重哮喘和停用或减量使用口服糖皮质激素的患者，开始使用布地奈德气雾剂的剂量如下：①成人一日200～1600μg，分2～4次吸入。轻症1次200～400μg，一日2次；重症一次200～400μg，一日4次，一日共800μg。②儿童。2～7岁，一日200～400μg，分2～4次吸入。7岁以上，一日200～800μg，分2～4次吸入。(2) 粉吸入剂。①成人治疗哮喘。原来未使用口服糖皮质激素，一次200～400μg，一日1次，或一次100～400μg，一日2次；原使用口服糖皮质激素，一次400～800μg，一日2次；成人的最高推荐剂量为一次800μg，一日2次。②6岁和6岁以上儿童治疗哮喘。原未使用口服糖皮质激素，一次200～400μg，一日1次，或一次100～200μg，一日2次；原使用口服糖皮质激素，一次200～400μg，一日1次；儿童的最高推荐剂量为一次400μg，一日2次。当哮喘控制后，应减至最低剂量。(3) 治疗哮喘维持剂量的范围，成人一日100～1600μg，儿童一日100～800μg。COPD的治疗，推荐剂量是400μg，一日2次；口服糖皮质激素的患者，若减少口服糖皮质激素剂量，本品用量和哮喘的推荐剂量相同。(4) 吸入用混悬液。①成人，严重哮喘期或减少口服糖皮质激素时的剂量，一次1～2mg，一日2次。维持剂量，一次0.5～1mg，一日2次。②儿童，一次0.5～1mg，一日2次。(5) 布地奈德福莫特罗粉吸入剂：①160μg/（4.5μg·喷），成人和12岁及12岁以上患者，一次1～2喷，一日2次。②80μg（4.5μg·喷），成人一次1～2喷，一日2次；或一次4喷，一日2次。12～17岁患者，一次1～2喷，一日2次。6岁和6岁以上患者一次2喷，一日2次。在常规治疗中，当一日2次剂量可有效控制症状时，应逐渐减少剂量直

至最低有效剂量，甚至一日1次给予本品。

【制剂与规格】布地奈德气雾剂：50μg/喷，200喷/瓶；或者200μg/喷，100喷/瓶。

布地奈德吸入用粉剂：100μg/喷，200喷/支。

布地奈德混悬液：①2ml：0.5mg；②2ml：1mg。

布地奈德福莫特罗粉吸入剂：①布地奈德80μg，富马酸福莫特罗4.5μg，60喷/支；②布地奈德160μg，富马酸福莫特罗4.5μg，60喷/支；120喷/支。

氟替卡松[保(乙)]

Fluticasone Propionate

【适应证】(1)用于支气管哮喘的预防性治疗，主要用于慢性持续期支气管哮喘。(2)用于重度慢性阻塞性肺疾病。

【注意事项】(1)下列情况慎用，如活动期或静止期肺结核患者、有糖尿病史的患者、妊娠期妇女。(2)儿童如长期接受吸入性糖皮质激素治疗，应定期监测身高。(3)哮喘的治疗应按照阶梯治疗原则进行，病人的病情应通过临床和肺功能试验进行监测。(4)本品不用于快速缓解急性哮喘症状。(5)长期大剂量接受吸入性糖皮质激素，会引起肾上腺皮质抑制；另外，在紧急情况下或择期手术当中，应考虑附加给予全身糖皮质激素治疗。(6)不可突然中断治疗。(7)一次用药后用水漱口。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见口腔及喉部的念珠菌病、声嘶；偶见免疫系统失调、皮肤过敏反应。罕见血管神经性水肿（主要为面部和口咽部水肿）、呼吸困难或支气管痉挛和过敏样反应，异常支气管痉挛、眼、脸部、嘴唇和喉部的水肿、白内障、青光眼，以及库欣综合征、肾上腺抑制、儿童和青少年生长发育迟缓、骨矿物质密度减少等内分泌失调，焦虑、睡眠紊乱、行为改变包括活动过度、易激怒（主要见于儿童）等精神失调。极罕见消化不良和关节痛。

【用法与用量】吸入：(1)成人及16岁以上儿童，一次100～1000μg，一日2次；一般一次250μg，一日2次。初始剂量：①轻度哮喘一次100～250μg，一日2次；②中度哮喘一次250～500μg，一日2次；③重度哮喘一次500～1000μg，一日2次。(2)4岁以上儿童，一次50～100μg，一日2次。

【制剂与规格】氟替卡松气雾剂：每罐60或120揿。①50μg/揿；②125μg/揿；③250μg/揿。

氟替卡松沙美特罗干粉吸入剂：①沙美特罗50μg，丙酸氟替卡松100μg（60泡或28泡）；②沙美特罗50μg，丙酸氟替卡松250μg（60泡或28泡）；③沙美特罗50μg，丙酸氟替卡松500μg（60泡或28泡）。

2.5 色甘酸盐及相关治疗和白三烯受体拮抗药

2.5.1 色甘酸盐及相关治疗

色甘酸钠及奈多罗米钠的作用途径，并不完全清楚。这些药对哮喘有弱的抗炎作用，可能基于其抗变态反应作用。因其效果不确切，已不再作为成人轻度哮喘的治疗药物选择。如使用，一般可试用4～6周。剂量应根据患者反应及时调整，一般起初一日3～4次，随后可减量。

色甘酸钠对哮喘的预防作用不如吸入肾上腺皮质糖皮质激素。有证据表明奈多罗米钠对5～12岁儿童的哮喘预防有效，色甘酸钠对治疗哮喘急性发作没有应用价值。

色甘酸钠可预防运动诱发哮喘，但作用较弱，尚需进一步证实。

如吸入色甘酸钠干粉引起支气管痉挛，可提前数分钟吸入选择性 β_2 受体激动药，如沙丁胺醇等。如果儿童不能耐受吸入干粉或气雾剂，可以改为吸入上述制剂的雾化溶液。

色甘酸钠[保(乙)]

Sodium Cromoglicate

【适应证】用于预防支气管哮喘发作，对轻度哮喘可能有治疗作用。

【注意事项】(1)肝肾功能不全者慎用。(2)孕妇及哺乳期妇女慎用。(3)不要中途突然停药，以免引起哮喘复发。(4)本

品并非直接舒张支气管而属预防性作用，故应在哮喘易发季节前1～3周用药。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】鼻刺痛、烧灼感、喷嚏、头痛、嗅觉改变、一过性支气管痉挛，罕见鼻出血、皮疹等。

【用法与用量】吸入。(1) 干粉吸入，一次20 mg，一日4次；症状减轻后，一日40～60 mg；维持量，一日20 mg。(2) 气雾吸入，一次3.5～7 mg，一日3～4次，一日最大剂量32 mg。

【制剂与规格】吸入用色甘酸钠胶囊：20 mg。

色甘酸钠气雾剂：① 14g : 700 mg（每揿含色甘酸钠3.5 mg）。② 19.97g : 700 mg（每揿含色甘酸钠5 mg）。

奈多罗米钠

Nedocromil Sodium

【适应证】预防支气管哮喘。

【注意事项】(1) 本品仅用于预防性治疗，急性哮喘发作时使用无效。(2) 应规律用药，无论白昼，一次使用时最好间隔相等时间。不要自行决定增加用量、使用次数或停药。(3) 为了防止口干或者嘶哑，用后应漱口。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】咽喉干燥或刺激感、嘶哑、口腔异味、胃部不适、头痛、恶心、呕吐；罕见皮疹、咽喉疼痛、言语困难、咳嗽、喘鸣、呼吸困难或者胸痛等。

【用法与用量】喷雾吸入：本药通过一种特殊的吸入装置吸入肺部。吸入之前摇晃药罐1分钟。饮水以湿润咽喉，将吸入器的接口放在离口两个指头远的地方，并且把头向后仰。按压吸入器的同时慢慢地深呼吸5秒钟，屏住呼吸10秒钟，以保证药物渗入肺中。如果处方要求吸入两次，两次之间必须间隔至少1分钟。①预防哮喘发作：一次4 mg，一日2次，必要时可增加到一日4次。②预防运动性哮喘：可于运动前吸入2～4 mg。

【制剂与规格】奈多罗米钠气雾剂：① 56喷：112 mg；② 112喷：224 mg。

酮替芬 [保（乙）]

Ketotifen

【适应证】用于过敏性支气管哮喘。

【注意事项】(1) 过敏体质慎用。(2) 孕妇及妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏、车辆驾驶员、机械操作者以及高空作业者工作时。

【不良反应】常见嗜睡、倦怠、口干、恶心等胃肠道反应。偶见头痛、头晕、迟钝、体重增加。

【用法与用量】口服：(1) 成人。一次1 mg，一日2次，极量一日4 mg。(2) 儿童。① 4～6岁，一次0.4 mg；② 6～9岁，一次0.5 mg；③ 9～14岁，一次0.6 mg。以上均为一日1～2次。

【制剂与规格】酮替芬1 mg相当于富马酸酮替芬1.38 mg，以下含量均以酮替芬计。

富马酸酮替芬片：① 0.5 mg；② 1 mg。

富马酸酮替芬胶囊：① 0.5 mg；② 1 mg。

富马酸酮替芬口服溶液：5 ml : 1 mg。

2.5.2 白三烯受体拮抗药

白三烯受体拮抗药孟鲁斯特和扎鲁斯特可阻断气道的半胱胺酸白三烯，单用或联合吸入糖皮质激素对哮喘有效。孟鲁斯特不比吸入常规剂量的糖皮质激素更有效，但两种药联合应用可提高疗效，减少吸入糖皮质激素的剂量。白三烯受体拮抗药对运动诱发哮喘及哮喘伴随鼻窦炎有效，但对已接受大剂量其他治疗药物的哮喘患者，其作用很有限。

有报道提出应用白三烯受体拮抗药患者可出现陈-施综合征，但其与白三烯受体拮抗药的因果关系尚不肯定，相当多已报道的病例发生的陈-施综合征是在减少口服糖皮质激素剂量时出现的。

应注意白三烯受体拮抗药引起的嗜酸性粒细胞增多，血管炎性皮疹，心肺系统异常或末梢神经异常。

孟鲁司特 [保（乙）]

Montelukast

【适应证】用于哮喘的预防和长期治

疗，包括预防白天和夜间的哮喘症状，治疗对阿司匹林敏感的哮喘患者以及预防运动诱发的支气管哮喘。也用于减轻季节性过敏性鼻炎引起的症状。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 口服本品不用于急性哮喘发作。(3) 在医师的指导下可逐渐减少合并使用的吸入糖皮质激素剂量，但不应突然停用糖皮质激素。(4) 在减少全身用糖皮质激素剂量时，偶见嗜酸性粒细胞增多症、血管性皮疹、肺部症状恶化、心脏并发症和神经病变。因此患者在减少全身糖皮质激素剂量时，应加以注意并做适当的临床监护。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者。

【不良反应】不良反应较轻微，通常不需中止治疗。临床试验中，本药治疗组有≥ 1%的患者出现与用药有关的腹痛和头痛。

【用法与用量】口服：①成人及 15 岁以上儿童，一次 10 mg，一日 1 次。② 6～14 岁儿童，一次 5 mg，一日 1 次；2 ~ 5 岁儿童，一次 4 mg，一日 1 次；睡前服用咀嚼片。

【制剂与规格】孟鲁司特钠片：10 mg。孟鲁司特钠咀嚼片：① 4 mg；② 5 mg。

扎鲁司特 [保(乙)]

Zafirlukast

【适应证】用于轻中度慢性哮喘的预防及长期治疗。对于用 β_2 受体激动药治疗不能完全控制病情的哮喘病人，本品可以作为一线维持治疗。

【注意事项】(1) 如发生血清转氨酶升高等肝功能不全症状或体征，应对患者进行相应的处理。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 若出现系统性嗜酸性粒细胞增多，有时临床体征表现为系统性脉管炎，与 Churg-Strauss 综合征临床特点相一致，常与减少口服糖皮质激素的用量有关。(4) 本品不适用解除哮喘急性发作时的支气管痉挛。(5) 不宜用本品突然替代吸入或口服的糖皮质激素治疗。(6) 对于易变性哮喘或不稳定性哮喘的治疗效果尚不明确。

【禁忌证】对本产品及其组分过敏、肝功能不全。

【不良反应】头痛、胃肠道反应、皮疹、过敏反应（荨麻疹和血管性水肿）、轻微的肢体水肿(极少)、挫伤后出血障碍、粒细胞缺乏症、AST 及 ALT 升高、高胆红素血症。罕见肝衰竭。

【用法与用量】口服：成人及 12 岁以上儿童，起始剂量一次 20 mg，一日 2 次。维持剂量，一次 20 mg，一日 2 次。根据临床反应，剂量可逐步增加至一次最大量 40 mg，一日 2 次时疗效更佳。

【制剂与规格】扎鲁司特片：① 20 mg；② 40 mg。

2.6 抗组胺药

所有抗组胺药在治疗鼻变态反应，特别是季节性过敏性鼻炎（花粉症）方面都具有潜在价值，此外在血管运动性鼻炎方面也可能会有一定的作用。这类药物能减少流涕和打喷嚏，但通常对鼻塞的疗效较差。抗组胺药可局部使用，如用于眼部，鼻腔和皮肤。

口服抗组胺药在治疗荨麻疹方面也有明显价值，可用于治疗荨麻疹性皮疹，瘙痒，昆虫叮咬及螫伤；另外还能用于药物过敏。在用肾上腺素治疗严重过敏反应和血管性水肿的急症时，可注射氯苯那敏或异丙嗪作为辅助治疗。此外抗组胺药（包括西替利嗪、赛克力嗪和异丙嗪）在治疗恶心和呕吐方面有用。

各种抗组胺药在作用持续时间以及嗜睡和抗毒蕈碱作用的发生率方面各不相同。很多老的抗组胺药的作用维持时间相对较短，但有些药物（如异丙嗪）作用时间可长达 24 个小时，大部分新型非镇静类抗组胺药都是长效的。

所有老的抗组胺药都有镇静作用，阿利马嗪和异丙嗪的镇静作用可能相对较强，而氯苯那敏和赛克力嗪则相对稍弱。这种镇静作用有时可用于治疗某些变态反应相关的瘙痒。几乎没有证据表明，任何一个老的“镇静类”抗组胺药优于同类的其他药物，而且患者对药物的反应也具有很大的个体差异。

与老的抗组胺药相比，非镇静类抗组

胺药，如西替利嗪、地氯雷他定、非索非那定、氯雷他定和咪唑斯汀，由于仅有轻微程度的穿透血脑屏障的作用，因此很少引起镇静或影响认知功能。

（1）牙科手术：抗组胺药作为止吐药物广泛使用，但对于咽反射过强的患者，地西泮或许更为有效。

（2）注意事项及禁忌证：镇静类抗组胺药具有明显的抗毒蕈碱作用，因此应慎用于前列腺肥大、尿潴留、易患闭角型青光眼者以及幽门十二指肠梗阻的患者。抗组胺药在肝病患者中也应慎重使用，对于肾损伤患者，可能必须减少剂量。癫痫患者也需慎用。儿童和老年人更容易发生不良反应。很多抗组胺药应避免用于卟啉病患者，尽管有些药物（如氯苯那敏和西替利嗪）被认为是安全的。

（3）不良反应：对于绝大多数老的抗组胺药而言，嗜睡是重要的不良反应。但也可能发生罕有的反常兴奋作用（尤其在大剂量用于儿童和老人时）。在经过数天治疗后，嗜睡程度有可能减轻。新型抗组胺药在这方面则很少出现嗜睡等问题（参见上文内容）。老的抗组胺药更常见的不良反应包括头痛、认知功能障碍和抗毒蕈碱作用，如尿潴留、口干、视物模糊，以及胃肠道功能紊乱等。抗组胺药其他罕见的不良反应包括低血压、锥体外系反应、头晕、精神障碍、抑郁、睡眠障碍、震颤、惊厥、心悸、心律失常、过敏反应（包括支气管痉挛、血管性水肿、严重过敏反应、皮疹和光敏性反应）、血液异常、肝功能异常以及闭角型青光眼。

苯海拉明 [基（基）、保（甲）]

Diphenhydramine

【适应证】(1) 急性重症过敏反应，可减轻输血或血浆所致的过敏反应。(2) 手术后药物引起的恶心呕吐。(3) 帕金森病和锥体外系症状。(4) 牙科局麻，当病人对常用的局麻药高度过敏时，1%苯海拉明液可作为牙科用局麻药。(5) 其他过敏反应病，不宜口服用药者。

【注意事项】(1) 对其他乙醇胺类高度过敏者，对本品也可能过敏。(2) 肾衰竭时，给药的间隔时间应延长。(3) 有下列情况慎用，如幽门十二指肠梗阻、消化性溃疡所致幽门狭窄、膀胱颈狭窄、甲状腺功能亢进症、心血管病、高血压以及下呼吸道感染（包括哮喘）。(4) 本品的镇吐作用可给某些疾病的诊断造成困难。老年人慎用。

【禁忌证】对本品过敏或对其他乙醇胺类药物高度过敏者；妊娠及哺乳期妇女、新生儿、早产儿、重症肌无力者；驾驶车船、从事高空作业、机械作业者工作期间禁用。

【不良反应】常见中枢神经抑制作用、共济失调、恶心、呕吐、食欲减退等；少见气急、胸闷、咳嗽、肌张力障碍等；有报道给药后可发生牙关紧闭并伴喉痉挛；偶可引起皮疹、粒细胞减少、贫血及心律失常。

【用法与用量】(1) 口服：一般一次25～50 mg，一日2～3次，餐后服用。(2) 深部肌内注射：一次20 mg，一日1～2次。

【制剂与规格】盐酸苯海拉明片：①12.5 mg；②25 mg；③50 mg。

盐酸苯海拉明糖浆：100 ml∶250 mg。

盐酸苯海拉明注射液：1 ml∶20 mg。

氯苯那敏 [基（基）、保（甲/乙）]

Chlorphenamine

【适应证】(1) 皮肤过敏症，如荨麻疹、湿疹、皮炎、药疹、皮肤瘙痒症、神经性皮炎、虫咬症、日旋旋光性皮炎。(2) 过敏性鼻炎。(3) 药物和食物过敏。

【注意事项】(1) 过敏体质者。(2) 有下列情况慎用，如妊娠及哺乳期妇女、膀胱颈梗阻、幽门十二指肠梗阻、甲状腺功能亢进症、青光眼、消化性溃疡、高血压、前列腺肥大症。(3) 新生儿、早产儿不宜使用。(4) 老年人较敏感，应适当减量。

【禁忌证】对本品过敏者，高空作业者、车辆驾驶人员、机械操作人员工作时间禁用。

【不良反应】主要有嗜睡、口渴、多尿、咽喉痛、困倦、虚弱感、心悸、皮肤瘀斑、出血倾向。

【用法与用量】(1) 口服：成人，一次4 mg，一日1～3次。(2) 肌内注射：一次5～20 mg，一日1～2次。

【制剂与规格】马来酸氯苯那敏片：4 mg。

氯苯那敏注射液：① 1 ml : 10 mg；② 2 ml : 20 mg。

赛庚啶[基(基)，保(甲)]

Cyproheptadine

【适应证】荨麻疹、丘疹性荨麻疹、湿疹、皮肤瘙痒等过敏性疾病。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如过敏体质者、2岁以下儿童、老年人。(2) 服药期间不得驾驶机、车、船、从事高空作业、机械作业及操作精密仪器。(3) 服用本品期间不得饮酒或含有酒精的饮料。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女，青光眼、尿潴留和幽门梗阻患者禁用，对本品过敏者。

【不良反应】嗜睡、口干、乏力、头晕、恶心等。

【用法与用量】口服：成人，一次2～4 mg，一日2～3次。

【制剂与规格】盐酸赛庚啶片：2 mg。

异丙嗪[基(基)，保(甲)]

Promethazine

【适应证】(1) 皮肤黏膜过敏。适用于长期的、季节性的过敏性鼻炎，血管运动性鼻炎，过敏性结膜炎，荨麻疹，血管神经性水肿，对血液或血浆制品的过敏反应，皮肤划痕症。(2) 晕动病。防治晕车、晕船、晕飞机。(3) 用于麻醉和手术前后的辅助治疗，包括镇静、催眠、镇痛、止吐。(4) 用于防治放射病性或药源性恶心、呕吐。

【注意事项】(1) 对吩噻嗪类药高度过敏者对本品也过敏。(2) 妊娠期妇女临产前1～2周应停药，以免诱发婴儿的黄疸和锥体外系症状。(3) 下列情况应慎用，如肝功能不全和各类肝脏疾病患者，肾衰竭，急性哮喘，膀胱颈部梗阻，骨髓抑制，心血管疾病，昏迷，闭角型青光眼，高血压，胃溃疡，前列腺肥大症状明显者，幽门或十二指肠梗阻，呼吸系统疾病（尤其是儿童服用本品后痰液黏稠，影响排痰，并可抑制咳嗽反射），癫痫患者（注射给药时可增加抽搐的严重程度），黄疸，Reye综合征（异丙嗪所致的锥体外系症状易与Reye综合征混淆），哺乳期妇女。(4) 小于3个月的婴儿体内药物代谢酶不足，不宜应用本品。还可能引起肾功能不全。新生儿或早产儿、患急性病或脱水的小儿及患急性感染的儿童，注射异丙嗪后易发生肌张力障碍。(5) 老年患者易发生头晕、呆滞、精神错乱、低血压，锥体外系症状，特别是震颤麻痹、不能静坐和持续性运动障碍，用量大或胃肠道外给药时更易发生。(6) 应用异丙嗪时，应特别注意有无肠梗阻，或药物的过量、中毒等问题，因其症状体征可被异丙嗪的镇吐作用所掩盖。

【禁忌证】禁用于新生儿、早产儿和婴儿、临产前1～2周妊娠期妇女。

【不良反应】常见嗜睡，视物模糊或色盲（轻度）、眩晕、口鼻咽干燥、耳鸣、皮疹、胃痛或胃部不适感、反应迟钝（儿童多见）、低血压、恶心或呕吐，甚至出现黄疸。还可增加皮肤光敏性、噩梦、易兴奋、易激动、幻觉、中毒性谵妄，儿童易发生锥体外系反应。少见血压增高，白细胞减少、粒细胞减少症及再生障碍性贫血。

【用法与用量】(1) 口服：①成人一次12.5 mg，一日4次，餐后及睡前服用，必要时睡前可增至25 mg。②儿童常用量为按体重一次0.125 mg/kg或按体表面积3.75 mg/m^2，每4～6小时1次。(2) 肌内注射：①成人。抗过敏，一次25 mg，必要时2～4小时后重复；严重过敏时可肌内注射25～50 mg，最高量不得超过100 mg，在特殊紧急情况下，可用灭菌注射用水稀释至0.25%，缓慢静脉注射。止吐，12.5～25 mg，必要时每4小时重复1次。镇静催眠，一次25～50 mg。②小儿抗过敏，按体重一次0.125 mg/kg或按体表面积3.75 mg/m^2，每4～6小时1次。止吐，按体重一次0.25～0.5 mg/kg或按体表面积7.5～15 mg/m^2，必要时每4～6小时重复；或一次12.5～25 mg，必要时每4～6小时重复。镇静催眠，必要时按体重一次0.5～1 mg/kg或一次12.5～25 mg。抗眩晕，睡前可按需给予，按体重0.25～

0.5 mg/kg 或按体表面积 7.5～15 mg/m^2；或一次 6.25 ～ 12.5 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】异丙嗪片：① 12.5 mg；② 25 mg。

盐酸异丙嗪注射液：2 ml：50 mg。

氮䓬斯汀[保(乙)]

Azelastine

【适应证】季节性过敏性鼻炎（花粉症）和常年性过敏性鼻炎及慢性特发性荨麻疹。

【注意事项】(1) 用药后不宜进行驾驶车辆、操作机器和高空作业等精神集中的工作。(2) 勿同时服用其他抗组胺药。(3) 饮酒或服用其他神经中枢系统抑制药物时应避免服用本品。

【禁忌证】对盐酸氮䓬斯汀、依地酸高度敏感的患者，妊娠前 3 个月的妇女，哺乳期妇女，6 岁以下儿童。

【不良反应】嗜睡、头晕、口干、多梦、咳嗽、腹痛、恶心、乏力、鼻痛等。

【用法与用量】(1) 口服。一次 2 mg，一日 2 次，早餐前 1 小时服用 1 次，临睡前服用 1 次，或遵医嘱。(2) 喷鼻。1 喷 / 鼻孔，早晚各 1 次，一日 2 次（相当于每日 0.56 mg 盐酸氮䓬斯汀剂量）或遵医嘱。喷药时保持头部直立。在症状消失前应坚持使用，但连续使用不超过 6 个月。

【制剂与规格】盐酸氮䓬斯汀片：① 0.5 mg；② 1 mg。

氮䓬斯汀喷鼻剂：10 ml：10 mg。

氯马斯汀

Clemastine

【适应证】过敏性鼻炎、荨麻疹及其他过敏性皮肤病。

【注意事项】(1) 孕期及哺乳期妇女慎用。(2) 老年人易发生低血压、精神错乱、呆滞和头晕，应酌情减量。(3) 用药期间不宜驾驶车辆、高空作业，从事危险工种、操作精密机器。

【禁忌证】下呼吸道感染（包括哮喘）患者禁用。新生儿、早产儿禁用。

【不良反应】可见嗜睡、眩晕、食欲减退、恶心、呕吐、口干、低血压、心悸、心动过速、疲乏、神经质、不安、震颤、失眠、欣快感、视觉模糊、抽搐、尿频、排尿困难、月经提前、痰液黏稠、鼻塞、胸闷、血小板减少、粒细胞减少、溶血性贫血、瘙痒、荨麻疹、过敏性休克等。

【用法与用量】口服：一次 1.34 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】富马酸氯马斯汀片：1.34 mg。

阿伐斯汀[保(乙)]

Acrivastine

【适应证】过敏性鼻炎、花粉病、慢性自发性荨麻疹、皮肤划痕症、胆碱能性荨麻疹、特发性获得性寒冷性荨麻疹和瘙痒性湿疹。

【注意事项】以下情况慎用，如肝功能损害者慎用，妊娠和哺乳期妇女，老年患者慎用，从事驾车和操作机器等高警觉性工作的患者慎用。

【禁忌证】已知对阿伐斯汀和曲普利啶过敏，肾衰竭。

【不良反应】瞌睡、皮疹、罕见过敏症状。

【用法与用量】口服：成人和 12 岁以上儿童，一次 8 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】阿伐斯汀胶囊：8 mg。

左卡巴斯汀[保(乙)]

Levocabastine

【适应证】过敏性鼻炎的症状治疗。用于减轻季节性过敏性鼻炎和过敏性结膜炎的症状。

【注意事项】(1) 左卡巴斯汀由肾脏排泄，故肾脏损伤者使用时应特别注意。(2) 除非特别需要，妊娠期妇女不宜使用本品。(3) 12 岁以下儿童不宜用本品。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者。

【不良反应】偶有使用本品后，出现暂时而轻微的局部刺痛感（鼻刺激和灼烧感）轻度头痛，罕见变态反应。

【用法与用量】(1) 经鼻给药：气雾剂，每侧鼻孔一次 100 μg（2 喷），一日 2 次。症状严重者可一日 3 ～ 4 次，应连续用药直至症状消除。患者用药前必须清洗鼻道，喷药时将药物吸入。第一次喷药前使气雾泵源充满，直至能较好地喷出药物，

然后再开始时使用。(2) 经眼给药：滴眼液，每侧一次1滴，一日3～4次，可持续用药，直至症状缓解。

【制剂与规格】盐酸左卡巴斯汀气雾剂：10 ml ∶ 5 mg（以左卡巴斯汀计）。

盐酸左卡巴斯汀滴眼液：4 ml ∶ 2 mg（以左卡巴斯汀计）。

依巴斯汀[保(乙)]

Ebastine

【适应证】荨麻疹、过敏性鼻炎、湿疹、皮炎、皮肤瘙痒症等。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如肝功能异常者，妊娠期和可能妊娠的妇女。(2) 动物实验表明本品可以进入乳汁，本品服用期间应避免哺乳。(3) 老年患者通常生理功能减退，应注意减小剂量，一日1次5 mg开始服药。(4) 驾驶或操纵机器期间慎用。

【禁忌证】对本品及其辅料过敏者。

【不良反应】有时困倦，偶见头痛、头晕、口干、胃部不适、嗜酸性粒细胞增多、ALT、ALP升高。罕见皮疹、水肿、心动过速。

【用法与用量】口服：成人，一次10 mg，一日1次。

【制剂与规格】依巴斯汀片：10 mg。

咪唑斯汀[保(乙)]

Mizolastine

【适应证】(1) 12岁以上儿童及成人所患的荨麻疹等皮肤过敏症状。(2) 季节性过敏性鼻炎（花粉症）及常年性过敏性鼻炎。

【注意事项】(1) 妊娠初始3个月内及哺乳期妇女不建议使用。(2) 下列情况慎用，如心脏病、心源性不适或心悸病史。(3) 老年患者可能对本品的镇静作用和对心脏复极化的潜在作用特别敏感。(4) 在个别病例中观察到，咪唑斯汀具有轻微的延长QT间期的可能性，该延长作用的程度适度，不伴随心律失常。对于高危患者特别是糖尿病、怀疑有电解质失衡和心律失常的患者，应当定时监测相关指标。(5) 禁与咪唑类抗真菌药（全身用药）或大环内酯类抗生素合用；以及已知可延长QT间期的药物如Ⅰ类和Ⅲ类抗心律失常药合用。不得嚼碎服用。从事驾驶或完成复杂工作者慎用。

【禁忌证】对本品任何一种成分过敏者、严重的肝功能损害病人、严重的心脏病或有心律失常（心动过缓、心律不齐或心动过速）病史、晕厥病史、严重心动过缓者；以及明显或可疑QT间期延长或电解质失衡，特别是低钾血症患者。

【不良反应】偶见思睡、乏力（通常为一过性）、食欲增加并伴有体重增加。罕见口干、腹泻（包括消化不良）或头痛。极罕见过敏反应、血管性水肿、全身性皮疹、荨麻疹、瘙痒、低血压、迷走神经异常（可引起惊厥）、焦虑、抑郁、白细胞计数减少、AST及ALT升高、血糖或电解质水平的轻微变化。

【用法与用量】口服：一次10 mg，一日1次。

【制剂与规格】咪唑斯汀片：10 mg。

咪唑斯汀缓释片：10 mg。

茶苯海明[保(乙)]

Dimenhydrinate

【适应证】用于防治晕动病（如晕车、晕船、晕机）所致的恶心、呕吐。

【注意事项】(1) 过敏体质者及老年人慎用。(2) 服用本品期间不得饮酒。(3) 不得与其他中枢神经抑制药（如镇静安眠药）及三环类抗抑郁药同服。

【禁忌证】对本品成分及其他乙醇胺药物过敏者，驾驶车船、从事高难度、有危险性的机器操作者，孕妇、新生儿、早产儿禁用。

【不良反应】表情呆滞、嗜睡、注意力不集中、头晕、恶心、呕吐；少见幻觉、幻想、夜间视力下降、皮疹、锥体外系症状。

【用法与用量】口服：①抗过敏，一次50 mg，一日2～3次。②预防晕动病，一次50 mg，出发前0.5～1小时口服。③出现恶心、呕吐、眩晕等症状时含服，成人一次20～40 mg，一日60～120 mg，一日不超过240 mg；7～12岁儿童一次10 mg，一日3～6次，一日不超过120 mg。

【制剂与规格】茶苯海明片：①

25 mg；② 50 mg。

茶苯海明含片：20 mg。

氯雷他定[保(乙)]

Loratadine

【适应证】缓解过敏性鼻炎的鼻部或非鼻部症状，如喷嚏、流涕、鼻痒、眼痒及眼部烧灼感等。减轻慢性荨麻疹及其他过敏性皮肤病的症状及体征。

【注意事项】(1) 对肝功能不全者，消除半衰期有所延长，请在医师指导下使用，可按一次 10 mg，隔日 1 次服用。(2) 以下情况慎用，如肾功能不全者，妊娠及哺乳期妇女，儿童。(3) 本品对心脏功能无影响，但偶有心律失常报道，有心律失常病史者应慎用。(4) 抗组胺药能清除或减轻皮肤对所有变应原的阳性反应，因此在做皮试前约 48 小时应停止使用氯雷他定。

【禁忌证】具有过敏反应或特异体质的患者禁用。

【不良反应】常见的不良反应有乏力、头痛、嗜睡、口干、胃肠道不适（包括恶心、胃炎）以及皮疹等；偶见健忘及晨起面部肢端水肿；罕见的不良反应有视物模糊、血压降低或升高、晕厥、癫痫发作、乳房肿大、脱发、过敏反应、肝功能异常、心动过速、心悸、运动功能亢进、黄疸、肝炎、肝坏死、多形性红斑等。

【用法与用量】口服：① 成人及大于 12 岁的儿童，一次 10 mg，一日 1 次。② 2 ~ 12 岁儿童，体重 > 30 kg，一次 10 mg，一日 1 次；体重 ≤ 30 kg，一次 5 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】氯雷他定片：① 5 mg；② 10 mg。

地氯雷他定

Desloratadine

【适应证】常年性过敏性鼻炎，过敏性结膜炎，荨麻疹。

【注意事项】(1) 肝功不良、膀胱颈阻塞或尿潴留、尿道张力过强、前列腺肥大、青光眼患者慎用。(2) 妊娠期妇女、儿童慎用。(3) 服药期间避免驾驶和操作机器。(4) 做皮试前 48 小时内不得使用本品，因其能消除或减轻皮肤阳性反应。

【禁忌证】对本产品活性成分或赋型剂过敏者禁用。严重高血压、严重冠心病、甲状腺功能亢进症者、哺乳期妇女禁用。

【不良反应】恶心、头晕、头痛、困倦、口干、乏力、偶见嗜睡，健忘及晨起面部肢端水肿。

【用法与用量】口服：成人及 12 岁以上儿童，一次 5 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】地氯雷他定片：5 mg。

曲普利啶[保(乙)]

Triprolidine

【适应证】用于治疗各种过敏性疾患，包括过敏性鼻炎（慢性鼻炎、喷嚏、流涕等）荨麻疹、皮肤瘙痒、支气管哮喘及动植物引起的过敏。

【注意事项】下列情况慎用，如眼内压增高、闭角型青光眼、甲状腺功能亢进症、血管性疾患及高血压、支气管哮喘、前列腺增生、膀胱颈阻塞、消化性溃疡、12 岁以下儿童。

【禁忌证】已知对本药有过敏反应的患者、急性哮喘发作期内的患者、早产婴儿及新生儿、哺乳期妇女均禁用。

【不良反应】偶见恶心、轻度口干、倦乏等，减量或停药后可自行消失。

【用法与用量】口服：①成人。一次 2.5 ~ 5 mg，一日 2 次。②儿童。7 ~ 12 岁儿童，一次 1.25 mg，一日 2 次；2 ~ 6 岁儿童一次 0.8 mg，一日 2 次；2 岁以下用量按体重 0.05 mg/kg，一日 2 次；或遵医嘱。

【制剂与规格】盐酸曲普利啶胶囊：2.5 mg。

曲普利啶片：2.5 mg。

去氯羟嗪[保(乙)]

Decloxizine

【适应证】过敏性疾病如急、慢性荨麻疹。

【注意事项】过敏体质者，妊娠及哺乳期妇女，老年人慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、新生儿、早产儿以及驾驶车船、从事高空作业、机械作业者工作期间禁用。

【不良反应】个别患者可有口干、嗜睡。

【用法与用量】口服：成人，一次 25～50 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】盐酸去氯羟嗪片：① 25 mg；② 50 mg。

西替利嗪[保(乙)]

Cetirizine

【适应证】(1) 季节性或常年性过敏性鼻炎。(2) 由过敏引起的荨麻疹及皮肤瘙痒。

【注意事项】(1) 肾功能损害者用量应减半。(2) 司机、操作机器或高空作业人员慎用。

【禁忌证】对本品过敏者，酒后，妊娠期及哺乳期妇女。

【不良反应】不良反应轻微且多为一过性，有困倦、嗜睡、头痛、眩晕、激动、口干及胃肠道不适等；偶有 AST 及 ALT 轻度升高。

【用法与用量】口服：①成人或 12 岁以上儿童，一次 10 mg，一日 1 次或遵医嘱。如出现不良反应，可改为早、晚各 5 mg。② 6～11 岁儿童，根据症状的严重程度不同，推荐起始剂量为 5 mg 或 10 mg，一日 1 次。③ 2～5 岁儿童，推荐起始剂量为 2.5 mg，一日 1 次；最大剂量可增至 5 mg，一日 1 次，或 2.5 mg 每 12 小时 1 次。

【制剂与规格】盐酸西替利嗪片：10 mg。

左西替利嗪[保(乙)]

Levocetirizine

【适应证】季节性过敏性鼻炎、常年性过敏性鼻炎、慢性特发性荨麻疹、过敏性结膜炎。

【注意事项】(1) 中重度肾功能损害患者应调整用法与用量。(2) 妊娠及哺乳期妇女、老年人、6 岁以下儿童慎用。(3) 合并服用乙醇或其他中枢神经系统抑制药可能导致其警戒性降低和操作能力削弱，从事驾车和操作机器等高警觉性工作的患者慎用。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者或者对哌嗪类衍生物过敏者，肾病晚期患者以及伴有特殊遗传性疾病（患有罕见的半乳糖不耐受症、原发性肠乳糖酶缺乏或葡萄糖 - 乳糖吸收不良）的患者。

【不良反应】常见头痛、嗜睡、口干、疲倦、衰弱、腹痛。少见乏力。罕见过敏反应、呼吸困难、恶心、血管性水肿、瘙痒、荨麻疹、皮疹和体重增加。本品服药过量症状为嗜睡，且无特效的解毒药。

【用法与用量】口服：成人及 6 岁以上儿童，一次 5 mg，一日 1 次。用少量水分散溶解后口服或直接吞服；空腹或餐中或餐后均可服用。中度肾功能损害者，每 2 日 1 次，5 mg；重度肾功能损害者，每 3 日 1 次，5 mg。

【制剂与规格】盐酸左西替利嗪分散片：5 mg。

盐酸左西替利嗪口服溶液：10 ml：5 mg。

洛度沙胺 用于支气管哮喘。口服：一次 1～3 mg；吸入给药：一次 0.1～1 mg，一日可吸入多次。(其他见 13.3.2)

特非那定

Terfenadine

【适应证】季节性过敏性鼻炎，常年性过敏性鼻炎，急、慢性荨麻疹等。

【注意事项】心脏病、电解质异常（如低钙、低钾、低镁血症）及甲状腺功能减退症者慎用。妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】明显肝功能损害者、器质性心脏病尤其是房室传导阻滞、先天性心电图 QT 间期延长综合征者、对本品过敏者。

【不良反应】头痛、头晕、疲乏、腹部不适、恶心、呕吐、食欲增加、大便习惯改变、口干、鼻干、咽干、皮疹；罕见室性心律失常、尖端扭转性室性心动过速、心室颤动、心搏骤停、低血压、心房扑动、晕厥、眩晕、心电图 QT 间期延长等，多由于药物相互作用引起。

【用法与用量】口服：成人及 12 岁以上儿童，一次 60 mg，一日 2 次。6～12 岁儿童，一次 30 mg，一日 2 次或遵医嘱。

【制剂与规格】特非那定分散片：60 mg。

特非那定胶囊：① 30 mg；② 60 mg。

特非那定混悬剂：5 ml：30 mg。

非索非那定

Fexofenadine

【适应证】(1) 季节性过敏性鼻炎。适用于缓解成人和6岁及6岁以上的儿童的季节性过敏性鼻炎相关的症状。如打喷嚏，流鼻涕，鼻、上腭、喉痒，眼痒、潮湿、发红。(2) 慢性特发性荨麻疹。适用于治疗成人和6岁及6岁以上年龄儿童的慢性特发性荨麻疹的皮肤症状，能够减轻瘙痒和风团的数量。

【注意事项】(1) 妊娠期间只有当潜在的利益远大于对胎儿的危害时才能使用非索非那定。(2) 药物可经过乳汁分泌，哺乳期妇女应慎用非索非那定。(3) 尚不能确定老年患者与年轻患者的反应是否有差异。但是由于该药物经肾脏排泄，肾脏功能损伤的患者药物毒性反应发生的危险性有可能增加。而老年患者很有可能有肾功能的下降，因此剂量的选择须谨慎，必要时需要进行肾功能监测。

【禁忌证】对本品成分过敏者。

【不良反应】(1) 治疗季节性过敏性鼻炎时发生的不良反应：恶心、痛经、嗜睡、消化不良、疲乏、头痛、背痛。6～11岁儿童患者发生的不良反应有头痛、意外损伤、咳嗽、发热、疼痛、中耳炎、上呼吸道感染。(2) 治疗慢性特发性荨麻疹时发生的不良反应：眩晕、嗜睡、背痛、鼻窦炎。

【用法与用量】口服：(1) 成人、12岁及12岁以上儿童。①季节性过敏性鼻炎，盐酸非索非那定的推荐剂量为60 mg，一日2次，或180 mg一日1次。肾功能不全的患者推荐起始剂量为60 mg，一日1次。②慢性特发性荨麻疹，盐酸非索非那定的推荐剂量为60 mg，一日2次。肾功能不全的患者推荐起始剂量为60 mg，一日1次。(2) 6～11岁儿童。①季节性过敏性鼻炎，盐酸非索非那定的推荐剂量为30 mg，一日2次，肾功能不全的儿童患者推荐起始剂量为30 mg，一日1次。②慢性特发性荨麻疹，盐酸非索非那定的推荐剂量为30 mg，一日2次，肾功能不全的儿童患者推荐起始剂量为30 mg，一日1次。

【制剂与规格】盐酸非索非那定胶囊：60 mg。

盐酸非索非那定片：①30 mg；②60 mg；③180 mg。

羟嗪[保(乙)]

Hydroxyzine

【适应证】(1) 轻度焦虑、紧张、情绪激动以及更年期焦虑和不安等神经和精神症状，更适用于伴有胃溃疡的焦虑患者。(2) 过敏性皮肤病和晕动病。

【注意事项】(1) 本药和氨茶碱存在交叉过敏。(2) 下列情况者慎用，如肺功能不全、哮喘、肝肾功能不全患者。(3) 用药前后及用药时应定期检查肝功能与白细胞计数。(4) 用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。(5) 服药期间勿饮酒。

【禁忌证】对本药过敏患者；白细胞减少患者、癫痫患者、妊娠及哺乳期妇女、6岁以下儿童。

【不良反应】嗜睡、口干、颤抖、惊厥、无力、头痛、晕眩、低血压与心悸。偶见皮疹、骨髓抑制，可能诱发癫痫。长期使用可产生依赖性。

【用法与用量】(1) 口服：一次25～50 mg，一日2～3次。(2) 肌内注射：一次100～200 mg。

【制剂与规格】盐酸羟嗪片：25 mg。

盐酸羟嗪注射液：2 ml：200 mg。

2.7 过敏原免疫治疗用药

免疫治疗是指使用含有室内尘螨、动物皮屑（猫或狗）、或牧草和树木花粉浸液的过敏原疫苗进行治疗，从而减轻患者的哮喘和过敏性鼻炎、结膜炎症状。对黄蜂和蜜蜂螫刺过敏的患者，采用含有黄蜂和蜜蜂毒液浸液的疫苗治疗可降低严重过敏反应和全身反应的发生风险。需要进行免疫治疗的患者，必须要在专科医院做出准确的诊断、评估和治疗。

脱敏疫苗应避免用于妊娠期妇女、5岁以下儿童、正在服用β受体拮抗药（因在发生过敏反应时肾上腺素可能无效），

或ACEI（发生类严重过敏反应的风险）的患者。

免疫治疗引起的过敏反应（尤其是对于黄蜂和蜜蜂毒液浸液）可危及生命，通常在注射后1小时内发生支气管痉挛，30分钟内出现严重过敏反应。因此，患者在注射后必须观察1小时。如果出现过敏反应的症状或体征（如皮疹、荨麻疹、支气管痉挛、衰弱），即使这些症状很轻微，也应该让患者留室观察，直到这些症状都完全消失。

每套过敏原浸液，通常包括一系列用于降低患者敏感性的逐渐递增过敏原剂量的小瓶。同时还有一套效价最高的用于维持治疗的小瓶。药品说明书必须标注过敏原的细节，每瓶的效价和用法。

奥马珠单抗

Omalizumab

【适应证】本品为抗免疫球蛋白E（IgE）的重组人源化（嵌合）单克隆抗体。用于过敏性哮喘，尤其是采用糖皮质激素吸入疗法不能控制症状的中重度、持续性哮喘。

【注意事项】(1) 使用本药开始治疗后，勿骤停全身性或吸入性糖皮质激素用药。(2) 用药后如出现风疹样皮疹，无须停药可自行好转，也可给予抗组胺药对抗。(3) 皮下给药前，本品每202.5 mg先用无菌注射用水1.4 ml完全溶解，然后皮下注射5～10秒。如40分钟后仍不能完全溶解，则不能使用。超过150 mg的剂量宜分次皮下给予。(4) 本品用量是以治疗前测得的血清IgE量（以ng或U计）及体重为依据，过敏性哮喘患者的基础IgE值一般为850 ng/ml（350 U/ml）。不可以本品治疗后测得IgE值为依据（因治疗后IgE升高可长达1年）。

【禁忌证】禁用于对本药过敏者。肝肾功能不全者、急性支气管痉挛或哮喘持续状态患者以及有对其他抗体制剂（尤其是来源于小鼠的制剂）过敏史者慎用。

【不良反应】可出现头痛、眩晕、疲乏、哮喘加重及急性而轻微的哮喘发作（与本药的关系均不明确）、上呼吸道感染和病毒性感染，偶可出现风疹样皮疹；常见皮下注射部位反应。过敏反应发生率约0.1%，多出现于皮下给药2小时内。

【用法与用量】(1) 静脉给药：用于中度或重度常年性过敏性哮喘，本药2.5 μg/kg或5.8 μg/kg（按血清IgE的ng/ml计），与口服和（或）吸入糖皮质激素联用。其中第1、4日分别给予半量，第7日给予全量，以后每2周给予全量1次，共20周。(2) 皮下给药：用于皮肤试验阳性或常年气源性致敏原体外反应阳性、吸入糖皮质激素不能完全控制症状的中至重度常年性哮喘，推荐用量一次150～375 mg，每2～4周1次（表2-8）。

【制剂与规格】注射用奥马珠单抗：202.5 mg（采用标准配置方法后，得到有效剂量为1.2 ml，即150 mg）。

表2-8 奥马珠单抗用于过敏性哮喘的剂量推荐表（"×"表示勿用药）

治疗前血清IgE (U/ml)	每4周用药 (mg) 体重 (kg)				每2周用药 (mg) 体重 (kg)			
	30～60	61～70	71～90	91～150	30～60	61～70	71～90	91～150
30～100	150	150	150	300	–	–	–	–
101～200	300	300	300	–	–	–	–	225
201～300	300	–	–	–	–	225	225	300
301～400	–	–	–	–	225	225	300	×
401～500	–	–	–	–	300	300	375	×
501～600	–	–	–	–	300	375	×	×
601～700	–	–	–	–	375	×	×	×

2.8 变态反应急症及其用药

肾上腺素（Adrenaline）能够在生理上逆转过敏反应，如严重过敏反应和血管性水肿相关的速发型症状（例如喉水肿，支气管痉挛和低血压）。

严重过敏反应，包括过敏性休克（anaphylactic shock），需要及时积极地治疗喉水肿，支气管痉挛和低血压。特应性体质的个体尤其容易发生这种反应。昆虫螫针是一种公认的风险（尤其是黄蜂和蜜蜂螫针）。某些食物，包括鸡蛋、鱼、牛奶、花生、坚果类也可能诱发严重过敏反应。与严重过敏反应关系密切的医药产品包括血液制品、疫苗、脱敏（变态原）制剂、抗菌药物、阿司匹林和其他非甾体抗炎药、肝素以及神经肌肉阻滞药物等。药物引起的严重过敏反应在肠外给药时更容易出现，因此在注射具有特殊风险的药物时必须备有急救设施。严重过敏反应也可能与食品和药品中的添加剂和辅料有关。某些药用产品中可能存在精制花生油，这一般不造成过敏反应，但检查制剂所有配方中是否含有致敏性脂肪或油脂是必要的。

对过敏性休克一线治疗包括保持气道通畅，恢复血压（患者平卧，并抬高下肢；如果可能出现呕吐，则让患者侧卧，最好是头低位），并注射肾上腺素。肾上腺素用法为肌内注射一次 0.5 mg（1：1 000 肾上腺素注射剂 0.5 ml）；紧急自行给药的肾上腺素剂量为 0.3 mg（1：1 000 肾上腺素注射剂 0.3 ml）。必要时，可在间隔 5 分钟后，根据血压、脉搏及呼吸功能（重要提示：可能需要经过稀释以后通过静脉通路给药，见下文）情况重复此剂量。吸氧也是很重要的措施。在给予肾上腺素注射后，接着使用抗组胺药（如，氯苯那敏 10 ～ 20 mg 缓慢静脉注射）作为有用的辅助治疗手段，持续使用 24 ～ 48 小时，可以防止复发。接受 β 受体拮抗药或抗抑郁药治疗的患者需要特别考虑（见肾上腺素项）。

如果病情持续恶化，则需接受进一步治疗，包括静脉补液、静脉注射氨茶碱或雾化吸入 β_2 受体激动药（如沙丁胺醇或特布他林）；除了吸氧以外，必要时可能还需要辅助呼吸和紧急气管切开。

在过敏性休克的起始治疗时，静脉注射糖皮质激素，例如琥珀酸氢化可的松 100 ～ 300 mg 是第二位的治疗措施。此类药物起效时间会在数小时之后，对症状较为严重的患者可以防止病情进一步恶化。

如果患者病情十分严重，以至有效循环可能不良，这时需注射的肾上腺素可能需要溶于稀释液中，由静脉途径输注。有关的注意事项、用量和浓度，详见下文。

对昆虫螫刺或食物严重过敏的患者，鼓励他们携带预装肾上腺素的注射器，以便在危险发生时自行注射。

（1）血管性水肿：血管性水肿（angioedema）一旦累及喉部，出现喉水肿，也是很危险的急症。此时，应即刻注射肾上腺素并吸氧。（具体方法见严重过敏反应）；抗组胺药和糖皮质激素需同时给予。必要时做气管插管。

（2）遗传性血管性水肿：C1 酯酶抑制药（新鲜冷冻血浆或部分纯化的形式）可终止遗传性血管水肿的急性发作，但作为长期预防不实用。氨基己酸和达那唑可预防长期和短期遗传性血管水肿。短期预防适用于口腔科操作之前几天应用，并持续 2 ～ 5 日。由于达那唑有雄性糖皮质激素样作用，应避免在儿童中应用。

（3）肌内注射肾上腺素：在治疗过敏性休克中，首选肌内注射肾上腺素。在休克患者，肌内注射比皮下注射在局部吸收更快，更可靠。（如有血液循环不良，应考虑静脉给予肾上腺素。有关注意事项和剂量详见下面的静脉用肾上腺素）。

对严重过敏史的患者，应该学会自己肌内注射肾上腺素（表 2-9）。发病时立即

表 2-9 过敏性休克患者应用肌内注射肾上腺素的剂量

年 龄	剂 量	1：1 000 (1 mg/ml)
6 个月以下	50 μg	0.05 ml
6 个月至 6 岁	120 μg	0.12 ml
＞6 ～ 12 岁	250 μg	0.25 ml
成人和青少年	500 μg	0.5 ml

必要时，根据血压、脉搏和呼吸功能情况，5 分钟内可重复此剂量。一般不推荐皮下注射

注射肾上腺素至关重要。以下肾上腺素剂量可供参考。

(4) 静脉注射肾上腺素：当患者症状严重怀疑血液循环不良，肌内注射肾上腺素常吸收不好，可考虑缓慢静脉注射肾上腺素，剂量为每分钟 100 μg，(1 ml 1∶1 000 肾上腺素)，总剂量为 500 μg (1∶1 000 肾上腺素 5 ml)，(稀释 1∶10 000 肾上腺素注射)。儿童剂量为按体重 10 μg/kg (0.1 ml/kg，1∶10 000 肾上腺素)，缓慢静注几分钟，直至生命体征恢复。高度警惕的是，必须明确区分 1∶10 000 和 1∶1 000 的浓度。应注意，当静脉穿刺困难时，可行肌内注射。

肾上腺素，用于因支气管痉挛所致严重呼吸困难，可迅速缓解药物等引起的过敏性休克，亦可用于延长浸润麻醉用药的作用时间。(其他见 4.10)

2.9 呼吸兴奋药

呼吸兴奋药主要通过刺激外周感受器和（或）呼吸中枢起作用，以改善患者的通气量，用于治疗药物（如吗啡、全麻药等）引起的呼吸抑制和 COPD 患者的通气功能衰竭（Ⅱ型呼吸衰竭）。其在呼吸衰竭治疗中的作用已大多被无创通气或有创机械通气所取代。目前，仅在患者存在机械通气禁忌和患者因高 CO_2 血症出现意识障碍时短期应用，以达到刺激患者清醒、能够配合治疗和排出呼吸道分泌物的作用。呼吸兴奋药多经静脉注射和静脉滴注给药，作用时间短。

在呼吸兴奋药治疗呼吸衰竭时，需保证气道通畅，并给予恰当的氧疗。因呼吸兴奋药可以兴奋骨骼肌增加机体的氧耗量，在气道阻塞、通气障碍、供氧不足条件下将加重低氧血症，使患者情况恶化。呼吸兴奋药还有刺激其他非呼吸肌或造成患者神志异常等不良反应。应在密切观察下使用。

尼可刹米 [基(基)，保(甲)]

Nikethamide

【适应证】用于中枢性呼吸抑制及各种原因引起的呼吸抑制。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 作用时间短暂，一次静脉注射只能维持作用 5～10 分钟，应视病情间隔给药。

【禁忌证】抽搐、惊厥、重症哮喘、呼吸道机械性梗阻。

【不良反应】常见瘙痒、烦躁不安、抽搐、恶心、呕吐等。大剂量时可出现血压升高、心悸、出汗、面部潮红、呕吐、震颤、心律失常、惊厥、甚至昏迷。

【用法与用量】皮下注射、肌内注射或静脉注射：①成人。常用量，一次 0.25～0.5 g，必要时 1～2 小时重复用药，极量一次 1.25 g。②小儿。常用量，6 个月以下，一次 75 mg；1 岁，一次 0.125 g；4～7 岁，一次 0.175 g。

【制剂与规格】尼可刹米注射液：① 1.5 ml∶375 mg；② 2 ml∶500 mg。

二甲弗林 [保(乙)]

Dimefline

【适应证】用于麻醉、催眠药物所引起的呼吸抑制，手术、外伤等引起的虚脱和休克，以及各种疾病引起的中枢性呼吸衰竭等。

【注意事项】本品安全范围较窄，剂量掌握不当易致抽搐或惊厥，应准备短效巴比妥类（如异戊巴比妥）做惊厥时急救用。静脉注射速度必须缓慢，并应随时注意病情。儿童、老年患者慎用。

【禁忌证】有惊厥病史者、肝肾功能不全者、孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】可见恶心、呕吐、皮肤烧灼感等。过量可致肌肉抽搐或惊厥，小儿尤易发生。

【用法与用量】(1) 肌内注射：一次 8 mg，临用前以注射用水 2 ml 溶解。(2) 静脉注射：一次 8～16 mg，临用前以 5% 葡萄糖注射液溶解并稀释，然后缓慢注射。(3) 静脉滴注：用于重症患者，一次 16～32 mg，临用前加氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液溶解并稀释，然后静脉滴注。

【制剂与规格】注射用盐酸二甲弗林：8 mg。

盐酸二甲氟林注射液：2 ml∶8 mg。

洛贝林[基(基), 保(甲)]

Lobeline

【适应证】用于新生儿窒息，一氧化碳、阿片中毒等各种原因引起的中枢性呼吸抑制。

【注意事项】(1) 本品可用于婴幼儿、新生儿。(2) 剂量较大时，能引起心动过速、传导阻滞、呼吸抑制甚至惊厥。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】恶心、呕吐、呛咳、头痛、心悸等。

【用法与用量】(1) 静脉注射：①成人，一次 3 mg；极量，一次 6 mg，一日 20 mg。②小儿，一次 0.3 ~ 3 mg，必要时每隔 30 分钟可重复使用；新生儿窒息可注入脐静脉 3 mg。(2) 皮下或肌内注射：①成人，一次 10 mg；极量，一次 20 mg，一日 50 mg。②小儿，一次 1 ~ 3 mg。

【制剂与规格】盐酸洛贝林注射液：①1 ml：3 mg；②1 ml：10 mg。

多沙普仑[保(乙)]

Doxapram

【适应证】用于呼吸衰竭。可用于麻醉药中枢抑制药过量引起的呼吸抑制。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 12 岁以下儿童慎用。(3) 用药时常规测定血压和脉搏，以防止药物过量。剂量过大时可引起血压升高、心率加快、甚至出现心律失常。(4) 静脉注射漏到血管外或静脉滴注时间太长，均能导致血栓静脉炎或局部皮肤刺激。静脉滴注速度不宜太快，否则可引起溶血。

【禁忌证】惊厥、癫痫、重度高血压、嗜铬细胞瘤、甲状腺功能亢进症、冠心病、颅内高压、严重肺部疾患者。

【不良反应】头痛、无力、恶心、呕吐、出汗、感觉奇热、腹泻及尿潴留。

【用法与用量】(1) 静脉注射：按体重一次 0.5 ~ 1.0 mg/kg，不超过 1.5 mg/kg，如需重复给药，至少间隔 5 分钟。每小时用量不宜超过 0.3 g。(2) 静脉滴注：按体重一次 0.5 ~ 1.0 mg/kg，临用前加 5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释（浓度为 1 mg/ml）后静脉滴注，直至获得疗效，一日总量不超过 3 g。

【制剂与规格】盐酸多沙普仑注射液：5 ml：100 mg。

2.10 氧

氧疗的目的是增加低氧血症患者的肺泡氧张力，减少呼吸功耗。吸氧浓度取决于不同患者与不同病情，错误的吸氧浓度可造成严重后果，甚至导致死亡。

对于无并发症的肺炎、肺栓塞、肺纤维化等，60%以下的吸氧浓度是安全的。此时，患者为低动脉血氧分压 (PaO_2) 伴有正常或较低二氧化碳分压 ($PaCO_2$)，因而氧疗不易产生低通气与二氧化碳潴留。

急性重症哮喘患者 $PaCO_2$ 起初可能偏低，但随着呼吸肌疲劳的出现 $PaCO_2$ 逐步升高，这在儿童尤为明显。这些患者往往需要高浓度氧疗，一旦 $PaCO_2$ 持续升高，应及时采取无创或有创正压机械通气以增加通气量，排出二氧化碳。在无条件做血气测定的场合，如转运患者途中建议应用高流量面罩，使实际吸氧浓度为 40% ~ 60%。

低浓度氧疗（控制氧疗）用于伴有呼吸衰竭的 COPD 患者，此时吸氧浓度低于30%。具有慢性呼吸衰竭的 COPD 患者，其主要病理基础是通气不足与通气或血流分布不均，低浓度吸氧即可纠正。治疗目的既要保证适当的氧合又不引起进一步二氧化碳潴留。为选择合适的氧浓度需重复血气测定，故治疗开始阶段最好在医院内进行，家庭氧疗只有在呼吸病专家指导下，才是安全的。建议接受家庭氧疗患者禁烟，一方面减少进一步肺损伤，另一方面也是为了避免失火。

乘飞机或其他交通工具时的吸氧方法应事先与有关部门及医生商议。

(1) 长程疗法：长程氧疗适应于下列患者：① COPD 患者在稳定期呼吸空气时，PaO_2 < 7.3 kPa (55 mmHg) 或 PaO_2 为 7.3 ~ 8 kPa (55 ~ 60 mmHg)，伴有如下情况之一，如继发性红细胞增多症、夜间低氧血症、末梢水肿、肺动脉高压。

COPD患者氧疗一般需一日吸氧15小时以上。②间质性肺疾病呼吸空气时 $PaO_2<$ 8 kPa（60 mmHg），或虽然 $PaO_2>8$ kPa（60 mmHg）但伴有呼吸困难活动障碍，也适于长程氧疗。③肺动脉高压不伴有肺实质改变而 $PaO_2<8$ kPa（60 mmHg）。④神经肌肉或骨骼肌病变，在专家指导下，可进行长程疗养。⑤阻塞性睡眠暂停，单纯CPAP治疗效果不满意者。⑥恶性肺肿瘤或其他疾病终末期 呼吸困难伴活动受限者。⑦心力衰竭呼吸空气时 $PaO_2<$ 7.3 kPa（55 mmHg），或伴有夜间低氧血症者。

（2）短程氧疗：短期间断氧疗可应用于COPD急性加重、肺间质病、心力衰竭及姑息治疗，以缓解其他疗法无效的呼吸困难。行短程氧疗的患者不应对吸氧有依赖性。短程氧疗也可用于疾病康复期，增加活动能力。只有当短程氧疗已证实确实能改善呼吸困难或运动耐力时，才建议持续进行。

（3）活动时氧疗：活动时氧疗，主要供长程氧疗患者需要运动时应用；非长程氧疗患者如有运动时血氧饱和度下降的证据，或氧疗确实能增加运动能力和血氧饱和度，也可推荐做活动时氧疗。活动时氧疗，不宜应用于吸烟者及心功能不全患者。

2.11 黏液溶解药

黏液溶解药是一类能改变痰中黏性成分、降低痰的黏滞度使其易于咳出的药物。因作用机制不同，主要有四类：①使痰液中酸性黏蛋白纤维断裂、从而降低黏稠度的药物，如溴己新、氨溴索；②结构中含巯基的氨基酸，可使黏蛋白分子裂解，从而降低痰液的黏稠度，如乙酰半胱氨酸等；③含有分解脱氧核糖核酸（DNA）的酶类，促使脓性痰中DNA分解，使脓痰黏度下降，如阿法链道酶、糜蛋白酶等；④表面活性剂，降低痰液的表面张力，使痰黏度降低。

黏液溶解药主要应用于咳嗽、咳痰，痰液黏稠不易咳出的支气管肺疾病，作为对症治疗，如慢性阻塞性肺疾病、慢性支气管炎、支气管扩张、肺脓肿等。有报道认为，对慢性阻塞性肺疾病，此类药物如乙酰半胱氨酸可能减少其急性加重频次。如应用黏液溶解剂4周治疗后无效，应停止使用该药。

由于黏液溶解药可破坏胃黏膜屏障，对有胃溃疡病病史的患者，使用此类药物宜谨慎。

溴己新 [基(基)，保(甲/乙)]

Bromhexine

【适应证】用于急、慢性支气管炎，支气管扩张等有多量黏痰而不易咳出的患者。

【注意事项】（1）胃炎、胃溃疡患者，过敏体质者慎用。（2）肝功能不全者在医师指导下使用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】偶有恶心，胃部不适、可能使血清转氨酶暂时升高。

【用法与用量】（1）口服：成人，一次8～16 mg，一日3次。（2）肌内或静脉注射：一次4 mg，一日8～12 mg。静脉注射时，用葡萄糖注射液稀释后使用。

【制剂与规格】盐酸溴己新片：8 mg。

盐酸溴己新注射液：2 ml：4 ml。注射用盐酸溴己新：4 mg。

氨溴索 [基(基)，保(甲/乙)]

Ambroxol

【适应证】适用于痰液黏稠不易咳出者。

【注意事项】（1）过敏体质者慎用。（2）孕妇及哺乳期妇女慎用。（3）应避免与中枢性镇咳药（如右美沙芬等）同时使用，以免稀化的痰液堵塞气道。（4）本品为黏液调节剂，仅对咳嗽症状有一定作用，在使用时应注意咳嗽、咳痰的原因，如使用7日后未见好转，应及时就医。

【禁忌证】对本品过敏者。妊娠初期3个月妇女。

【不良反应】上腹部不适、食欲缺乏、胃痛、胃部灼热、消化不良、恶心、呕吐、腹泻、皮疹；罕见头痛、眩晕、血管性水肿。快速静脉注射可引起腰部疼痛和疲乏无力感。

【用法与用量】（1）口服：①成人及12岁以上儿童：一次30 mg，一日3次，

餐后口服。长期服用一次 30 mg，一日 2 次。缓释胶囊一次 75 mg，一日 1 次，餐后口服。② 12 岁以下儿童：5 ~ 12 岁，一次 15 mg，一日 3 次；2 ~ 5 岁，一次 7.5 mg，一日 3 次；2 岁以下儿童，一次 7.5 mg，一日 2 次。餐后口服。长期服用者，一日 2 次即可。缓释胶囊按体重一日 1.2 ~ 1.6 mg/kg 计算。(2) 雾化吸入：一次 15 ~ 30 mg，一日 3 次。(3) 肌内注射：将本品用 5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液 10 ~ 20 ml 稀释后缓慢注射。(4) 皮下注射：一次 15 mg，一日 2 次。(5) 静脉注射：①成人及 12 岁以上儿童，一次 15 mg，一日 2 ~ 3 次，严重病例可以增至一次 30 mg。每 15 mg 用 5 ml 无菌注射用水溶解，注射应缓慢。②儿童。6 ~ 12 岁，一次 15 mg，一日 2 ~ 3 次；2 ~ 6 岁，一次 7.5 mg，一日 3 次；2 岁以下，一次 7.5 mg，一日 2 次。以上注射均应缓慢。婴儿呼吸窘迫综合征 (IRDS)，一次 7.5 mg/kg，一日 4 次，应使用注射泵给药，静脉注射时间至少 5 分钟。(6) 静脉滴注：一次 15 ~ 30 mg，一日 2 次，用氯化钠注射液或 5%葡萄糖注射液 100 ml 稀释后 30 分钟内缓慢滴注。

【制剂与规格】盐酸氨溴索片：30 mg。

盐酸氨溴索溶液：① 5 ml : 15 mg；② 5 ml : 30 mg；③ 60 ml : 180 mg。

盐酸氨溴索注射液：2 ml : 15 mg。

注射用盐酸氨溴索：15 mg。

盐酸氨溴索气雾剂：2 ml : 15 mg。

糜蛋白酶 [保(乙)]

Chymotrypsin

【适应证】用于上呼吸道浓痰的液化。

【注意事项】(1) 使用时须严密观察，如发生过敏反应，应立即停止使用，并用抗组胺类药治疗。(2) 本品不可静脉注射。(3) 本品溶解后不稳定，宜用时新鲜配制。

【禁忌证】严重肝病、凝血功能不正常者以及正在应用抗生素患者。

【不良反应】注射部位出现疼痛、肿胀和红斑。

【用法与用量】用前将本品以氯化钠注射液适量溶解，配成 2 ~ 5 mg/ml 的溶液，喷雾吸入。

【制剂与规格】注射用糜蛋白酶：① 800 U；② 4 000 U。

乙酰半胱氨酸 [保(乙)]

Acetylcysteine

【适应证】用于浓稠痰黏液过多的呼吸系统疾病，如急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、支气管扩张症。

【注意事项】(1) 支气管哮喘患者在用本品治疗期间，如发生支气管痉挛应立即停药。(2) 有消化道溃疡病史者慎用。(3) 肝功能不全者本品血液浓度增高，应适当减量。

【禁忌证】对本品过敏，孕妇，哺乳期妇女用药期间停止哺乳，支气管哮喘。

【不良反应】偶见恶心、呕吐，极少见皮疹、支气管痉挛。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次 0.2 g，一日 2 ~ 3 次。②儿童，一次 0.1 g，一日 2 ~ 3 次。(2) 静脉滴注：本品 8 g 用 10%葡萄糖注射液 250 ml 稀释后静脉滴注，一日 1 次，疗程 45 日。(3) 喷雾吸入：以 0.9%氯化钠溶液配成 10%溶液喷雾吸入，一次 1 ~ 3 ml，一日 2 ~ 3 次。(4) 气管滴入：以 5%溶液经气管插管或直接滴入气管内，一次 1 ~ 2 ml，一日 2 ~ 6 次。(5) 气管注入：以 5%溶液用注射器自气管的甲状软骨环骨膜处注入气管腔内，一次 2 ml，一日 2 次。

【制剂与规格】乙酰半胱氨酸胶囊：200 mg。

乙酰半胱氨酸颗粒：① 100 mg；② 200 mg。

乙酰半胱氨酸喷雾剂：① 500 mg；② 1 000 mg。

乙酰半胱氨酸注射液：20 ml : 4 g。

注射用乙酰半胱氨酸：8 g。

桃金娘油

Myrtol

【适应证】(1) 黏液溶解性祛痰药。(2) 适用于急、慢性鼻窦炎和支气管炎。(3) 用于支气管扩张、慢性阻塞性肺疾病、肺部真菌感染、肺结核、硅肺等。(4) 可在支气管造影术后使用，以利于造影剂的排出。

【注意事项】(1) 本品为肠溶胶囊，不可打开或嚼破后服用。(2) 本品宜在餐前30分钟用较多的凉开水送服。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】罕见胃肠道不适、原有的肾结石和胆结石的移动。偶见变态反应，如皮疹、面部红肿、呼吸困难和循环障碍。

【用法与用量】口服：(1) 成人，服用成人装。①急性患者，一次1粒，一日3～4次。②慢性患者，一次1粒，一日2次。(2) 4～10岁儿童，服用儿童装。①急性患者，一次1粒，一日3～4次。②慢性患者，一次1粒，一日2次。本品较宜在餐前30分钟用较多的凉开水送服。勿将胶囊掰开或咀嚼服用。

【制剂与规格】标准桃金娘油胶囊：①成人装，每粒含300 mg；②儿童装，每粒含120 mg。

羧甲司坦[保(乙)]

Carbocisteine

【适应证】用于支气管炎、支气管哮喘等疾病引起的痰液黏稠、咳出困难。

【注意事项】孕妇及哺乳期妇女、儿童慎用。消化道溃疡史患者慎用。本品仅对咳痰症状有一定作用。

【禁忌证】对本品过敏，消化道溃疡活动期。

【不良反应】恶心、胃部不适、腹泻、轻度头痛、皮疹。

【用法与用量】口服：(1) 成人，一次0.25～0.5 g，一日3次。(2) 儿童，①2～4岁，一次0.1 g，一日3次；②5～8岁，一次0.2 g，一日3次；③8～12岁，一次0.25 g，一日3次。

【制剂与规格】羧甲司坦片：①250 mg；②600 mg。

羧甲司坦片（儿童用）：100 mg。

羧甲司坦颗粒：①200 mg；②500 mg。

羧甲司坦泡腾片：500 mg。

羧甲司坦糖浆：2%（20 mg/ml）。

厄多司坦

Erdosteine

【适应证】用于急性和慢性支气管炎痰液黏稠所致的呼吸道阻塞。

【注意事项】(1) 胃及十二指肠溃疡患者慎用。(2) 应避免与强力镇咳药同时应用。妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏，孕妇及哺乳期妇女，不足15岁的儿童，严重肝肾功能不全者禁用。

【不良反应】偶见较轻微的头痛和胃肠道反应，如恶心、呕吐、上腹隐痛等症状。

【用法与用量】口服：一次300 mg，一日2次。

【制剂与规格】厄多司坦片：150 mg。

美司坦

Mecysteine

【适应证】用于慢性支气管炎、感冒等引起的痰液稠厚和咳痰困难。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 有消化道溃疡病史患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者，消化道溃疡活动期。

【不良反应】偶见轻度头晕、恶心、胃部不适。

【用法与用量】口服：成人，一次100 mg，一日3次。

【制剂与规格】盐酸美司坦片：100 mg。

阿法链道酶

Dornase Alfa

【适应证】用于有大量脓痰的呼吸系统感染如支气管扩张、肺脓肿溃疡等。

【注意事项】(1) 用于治疗支气管扩张、肺脓肿溃疡时，若胸膜腔有纤维蛋白膜块沉积或有黏性渗出物堵塞，可直接注射到腔内。(2) 用药后若发生咽部疼痛及一次喷雾后应立即漱口。(3) 本药在室温下或过度稀释后可迅速灭活，溶液须临用前配制。

【禁忌证】禁用于对牛血清生物制剂过敏的患者、对汞化合物包括硫柳汞过敏的患者、急性化脓性蜂窝织炎患者、有支气管胸腔瘘管的活动性肺结核患者。

【不良反应】咽部疼痛、乏力、胃肠道反应、皮疹、发热等。

【用法与用量】(1) 吸入：一次 5 万～10 万 U，临用前，一次剂量用 10%丙二醇或氯化钠注射液 2 ～ 3 ml 溶解，一日 3 ～ 4 次，连用 4 ～ 6 日。(2) 腔内注射：一次 5 万 U。(3) 肌内注射：一次 100 万 U，隔日 1 次。

【制剂与规格】注射用阿法链道酶：① 10 万 U；② 25 000 U。

2.12 镇咳药

咳嗽 (cough) 是由多种原因所产生的一种临床症状，引起咳嗽的常见原因有急性或慢性支气管炎、支气管哮喘、胃食管反流病、支气管哮喘、鼻炎等，某些药物，如血管紧张素转换酶抑制药；此外，吸烟、环境污染、甚至个人习惯也可出现咳嗽症状。因此，应针对不同原因处理方能有效缓解咳嗽症状。

咳嗽是一种保护性反射活动，咳嗽可将呼吸道内的黏液和异物排出，在排出后咳嗽症状多减轻或缓解；如痰液较多，单用镇咳药将使痰液滞留在气道，无益而有害（如慢性支气管炎、支气管扩张等）。因此，只有在无痰或少痰而咳嗽频繁、剧烈时应用镇咳药。

镇咳药，根据其作用机制，可分为中枢性镇咳药和外周性镇咳药。可待因作为镇咳药，作用强而迅速，此外，本品还具有镇痛作用，其不良反应包括便秘和一定依赖性。右美沙酚和福尔可定的镇咳作用较强，且不良反应较小。

含可待因或其他阿片类的镇咳制剂，一般不宜给儿童应用，1 岁以下儿童更应完全不用。

当肺癌出现异常痛苦的咳嗽时，可应用吗啡、美沙酮等吗啡受体激动药；但在其他原因所致的咳嗽，因可引起痰液潴留、抑制呼吸以及成瘾性，则属禁忌。

可待因 [保(乙)]

Codeine

【适应证】镇咳，用于较剧的频繁干咳，如痰液量较多宜和用祛痰药。

【注意事项】(1) 本品可透过胎盘使婴儿成瘾，引起新生儿的戒断症状，如过度啼哭、打喷嚏、打呵欠、腹泻、呕吐等。分娩期应用本品可以起新生儿呼吸抑制，妊娠妇女慎用。(2) 自乳汁排除，哺乳期妇女慎用。(3) 下列情况应慎用，如支气管哮喘、急腹症；在诊断未明确时，可能因掩盖真相造成误诊；胆结石，可引起胆管痉挛；原因不明的腹泻，可使肠道蠕动减弱、减轻腹泻症状而误诊；颅脑外伤或颅内病变，本品可引起瞳孔变小，模糊临床体征；前列腺肥大病因本品易引起尿潴留而加重病情。(4) 重复给药可产生耐药性，久用有成瘾性。(5) 本品为国家特殊管理的麻醉药品，长期应用可产生耐受性、成瘾性，也可引起便秘。(6) 务必严格遵守国家对麻醉药品的管理条例规定使用。(7) 磷酸可待因缓释片必须整片吞服，不可截开或嚼碎。

【禁忌证】对本品过敏的患者禁用；多痰患者禁用；婴幼儿、未成熟新生儿禁用。

【不良反应】常见幻想，呼吸微弱，缓慢或不规则，心率或快或慢；少见惊厥，耳鸣，震颤或不能自控的肌肉运动，荨麻疹，瘙痒、皮疹或脸肿等过敏反应；长期应用产生依赖性，常用量引起依赖性的倾向较其他吗啡类为弱。典型症状为食欲减退、腹泻、牙痛、恶心呕吐、流涕、寒战、打喷嚏、打呵欠、睡眠障碍、胃痉挛、多汗、衰弱无力、心率增速、情绪激动或原因不明的发热。

【用法与用量】口服：①成人，一次 15 ～ 30 mg，一日 2 ～ 3 次。极量一次 100 mg，一日 250 mg。②儿童，按体重一日 1 ～ 1.5 mg/kg，分 3 次服。

【制剂与规格】磷酸可待因片：① 15 mg；② 30 mg。

磷酸可待因缓释片：① 15 mg；② 30 mg。

磷酸可待因糖浆：① 10 ml；② 100 ml。

复方磷酸可待因溶液：每 1 ml 含磷酸可待因 1 mg，盐酸麻黄碱 0.8 mg，马来酸氯苯那敏 0.2 mg，氯化铵 (NH_4Cl) 22 mg。用于咳嗽，特别是剧烈、频繁的咳嗽。口服，成人一次 10 ～ 15 ml，一日 3 次。儿童用量酌减或遵医嘱。

可愈糖浆：100 ml ：磷酸可待因

0.20 g，愈创木酚甘油醚2 g。用于各种原因引起的剧烈咳嗽口服。12岁以上儿童及成年人一次10 ml，一日服3次，24小时不得超过30 ml；6～12岁儿童一次5 ml，一日服3次，24小时不得超过15 ml；2～6岁儿童一次2.5 ml，一日服3次，24小时不得超过7.5 ml；或遵医嘱。

福尔可定

Pholcodine

【适应证】用于剧烈干咳和中等度疼痛。

【注意事项】(1) 可致成瘾性。(2) 新生儿和儿童易于耐受此药，不致引起便秘和消化紊乱。

【不良反应】偶见恶心、嗜睡、具有吗啡类药品等不良反应。

【用法与用量】口服：①成人一次5～15 mg，一日3次。极量一日60 mg。②儿童：1～5岁，一次2～2.5 mg，一日3次；5岁以上，一次2.5～5 mg，一日3次。

【制剂与规格】福尔可定片：① 5 mg；② 10 mg；③ 15 mg。

喷托维林[基(基)，保(甲)]

Pentoxyverine

【适应证】镇咳。适用于急性支气管炎、慢性支气管炎等上呼吸道引起的无痰干咳。

【注意事项】本药无祛痰作用，痰多的患者慎用。

【禁忌证】青光眼、心力衰竭、孕妇及哺乳期妇女、驾车及操作机器者。

【不良反应】偶有便秘、轻度头痛、头晕、嗜睡、口干、恶心、腹泻、皮肤过敏等。

【用法与用量】口服：①成人，一次25 mg，一日3～4次。②儿童，5岁以上，一次6.25～12.5 mg，一日2～3次。

【制剂与规格】枸橼酸喷托维林片：25 mg。

阿桔片

Compound Platycodon Tablets

【适应证】有镇咳、祛痰作用。可用于急性支气管炎及慢性支气管炎等有痰的咳嗽。

【注意事项】因本品有成瘾性，不应长期使用。应按麻醉药品管理。

【禁忌证】严重肝功能不全、肺源性心脏病、支气管哮喘者、儿童、孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】长期使用易成瘾。

【用法与用量】口服：一次1～2片，一日3次。

【制剂与规格】阿桔片：每片含阿片粉30 mg、桔梗粉90 mg、硫酸钾180 mg。

苯丙哌林

Benproperine

【适应证】主要用于刺激性干咳，如急、慢性支气管炎及各种原因引起的咳嗽。

【注意事项】(1) 孕妇慎用本品。(2) 高龄者因肝、肾功能多减退，药物剂量应以一日10 mg开始。(3) 服用时需整粒吞服，切勿嚼碎，以免引起口腔麻木。(4) 本药无祛痰作用，如咳痰症状明显，不宜使用。(5) 服药者不可驾驶汽车及进行有危险性的机械操作。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】偶见口干、胃部灼烧感、头晕、嗜睡、食欲缺乏、乏力和药疹等。

【用法与用量】口服：一次20～40 mg，一日3次。

【制剂与规格】磷酸苯丙哌林片：20 mg。

磷酸苯丙哌林胶囊：20 mg。

二氧丙嗪[保(乙)]

Dioxopromethazine

【适应证】用于急、慢性气管炎和各种疾病引起的咳嗽。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用。(2) 癫痫病患者慎用。(3) 治疗量与中毒量接近，不得超过极量。

【禁忌证】高空作业及驾驶车辆、操纵机器者。

【不良反应】常见困倦、乏力、嗜睡。

【用法与用量】口服：成人常用量为一次5 mg，一日3次；极量为一次10 mg，一日30 mg。直肠给药，一次10 mg，

一日2次。小儿按体重0.2 mg/kg，一日2次。

【制剂与规格】盐酸二氧丙嗪片：5 mg。

盐酸二氧丙嗪栓：①2.5 mg；②10 mg。

右美沙芬[保(乙)]

Dextromethorphan

【适应证】用于干咳，适用于感冒、咽喉炎以及其他上呼吸道感染时的咳嗽。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 肝、肾功能不全者慎用。(3) 孕妇慎用。(4) 哮喘、痰多者慎用。(5) 用药7日，如症状未缓解，请停药就医。

【禁忌证】有精神病史，妊娠3个月内及哺乳期妇女，对本品过敏者，驾驶及操作机器者，服用单胺氧化酶抑制药停药不满2周的患者。

【不良反应】头晕、头痛、嗜睡、易激动、嗳气、食欲减退、便秘、恶心、皮肤过敏，停药后上述反应可自行消失。过量可引起神志不清，支气管痉挛，呼吸抑制。

【用法与用量】口服：①成人，一次10～15 mg，一日3～4次。②儿童，2岁以下不宜用；2～6岁，一次2.5～5 mg，一日3～4次；6～12岁，一次5～10 mg，一日3～4次。

【制剂与规格】氢溴酸右美沙芬片：①10 mg；②15 mg。

氢溴酸右美沙芬胶囊：15 mg。

氢溴酸右美沙芬咀嚼片：①5 mg；②15 mg。

右美沙芬缓释混悬液：100 ml：0.6 g（以氢溴酸右美沙芬计）。

2.13 祛痰药

主要指通过刺激胃黏膜反射性地促使气道腺体分泌增加，使痰液稀释易于咳出的一类药物，包括氯化铵、吐根等。然而其确实的临床效果不易确证，通常以合剂形式应用，至少有安慰剂效果。

氯化铵

Ammonium Chloride

【适应证】用于干燥及痰不易咳出者，（多用于急性呼吸道炎症时痰黏稠不易咳出，常与其他止咳祛痰药配成复方制剂）。

【注意事项】(1) 用首7日未缓解者，立即就医。(2) 肝肾功能异常者、老年人、过敏体质者慎用。(3) 消化性溃疡患者、孕妇及哺乳期妇女在医生指导下使用。

【禁忌证】对本品过敏，肝肾功能严重损害，尤其是肝性脑病、肾衰竭、尿毒症患者，代谢性酸中毒。

【不良反应】可引起恶心、呕吐、胃痛等刺激症状。

【用法与用量】口服：①成人常用量。祛痰，一次0.3～0.4g，一日3次。酸化尿液，一次0.6～2g，一日3次。②小儿常用量。按体重一日40～60 mg/kg，或按体表面积1.5 g/m^2，分4次服。

【制剂与规格】氯化铵片：0.3 g。

复方甘草片（合剂）[保(甲)]

Compound Liquorice Tables (Mixture)

【适应证】用于镇咳祛痰。

【注意事项】(1) 妊娠、哺乳期妇女慎用。(2) 胃炎及胃溃疡慎用。(3) 本品服用不宜超过7日。

【禁忌证】对本品成分过敏者禁用。

【不良反应】有轻微恶心、呕吐。

【用法与用量】口服或含化：①片剂，一次3～4片，一日3次。②合剂，一次5～10 ml，一日3次。

【制剂与规格】复方甘草片：每片含甘草流浸膏粉112.5 mg、阿片粉4 mg、樟脑2 mg、八角茴香油2 mg、苯甲酸钠2 mg。

复方甘草合剂：每100 ml含甘草流浸膏12 ml、甘油12 ml、酒石酸锑钾0.024 g、浓氨溶液适量、复方樟脑酊12 ml、乙醇3 ml。

复方甘草氯化铵合剂：含3%氯化铵的复方甘草合剂。

2.14 减鼻充血药

口服减鼻充血药没有局部使用的药物有效，但其优点为停药后不造成鼻充血反弹。目前多使用伪麻黄碱，它很少有拟交

感神经效应。

注意：全身性减鼻充血药在有糖尿病、高血压、甲状腺功能亢进症、闭角型青光眼、前列腺增生、肾功能损害、妊娠和缺血性心肌病的患者应慎用；使用单胺氧化酶药物的患者应避免使用。和其他拟交感作用药物有叠加效应。

伪麻黄碱

Pseudoephedrine

【适应证】用于减轻感冒、鼻炎（包括过敏性鼻炎）及鼻窦炎引起的鼻充血症状。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如甲状腺功能亢进症、糖尿病、缺血性心脏病、眼压高、肠梗阻、前列腺肥大导致排尿困难、肝肾功能不全、孕妇及哺乳期妇女。(2) 本品为管制品种，生产、经营和使用按有关规定执行。(3) 服药后如症状没有改善或出现发热、腹痛或呕吐，应及时就医。(4) 连续服药不得超过7日，服用剂量不得超过推荐的剂量，高剂量可能产生神经过敏、眩晕和嗜睡，应予注意。(5) 避免与其他拟交感神经药和减轻鼻黏膜充血药同时使用。(6) 服用复方盐酸伪麻黄碱缓释胶囊不得驾驶及高空作业，不得操作机械和精密仪器。(7) 服用复方盐酸伪麻黄碱缓释胶囊不得饮酒或含有酒精的饮料。

【禁忌证】严重的高血压、冠心病、服用单胺氧化酶抑制药及对盐酸伪麻黄碱敏感或不能耐受的患者禁用。

【不良反应】有较轻的兴奋作用、失眠、头痛。

【用法与用量】口服：成人，一次0.12 g，一日2次。

【制剂与规格】盐酸伪麻黄碱缓释片：120 mg。

复方盐酸伪麻黄碱缓释胶囊：每粒含盐酸伪麻黄碱90 mg，马来酸氯苯那敏4 mg。口服：一次1粒，每12小时1次。

酚麻美敏片：每片含对乙酰氨基酚325 mg，盐酸伪麻黄碱30 mg，氢溴酸右美沙芬15mg，马来酸氯苯那敏2 mg。口服：成人及12岁以上儿童，一次1片，每6小时1次。

第 3 章 消化系统疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 消化性溃疡
- 幽门螺杆菌感染
- 胃炎
- 急性胃炎
- 慢性胃炎
- 胃食管反流病
- 炎症性肠病
- 溃疡性结肠炎
- 克罗恩病
- 抗生素相关性肠炎
- 急性腹泻
- 肠易激综合征
- 便秘
- 肛门和直肠疾病
- 急性胰腺炎
- 急性胆囊炎
- 肝硬化
- 门静脉高压症
- 腹水
- 胃底食管静脉破裂出血
- 自发性细菌性腹膜炎

- 肝肾综合征
- 肝性脑病
- 原发性胆汁性肝硬化

3.1 消化性溃疡及其药物治疗

消化性溃疡（peptic ulcer）指胃肠道黏膜在消化道内胃酸和胃蛋白酶等的腐蚀作用下发生的溃疡，其深度达到或穿透黏膜肌层。胃、十二指肠溃疡是常见的消化性溃疡，另外，在胃食管反流病（gastroesophageal reflux disease，GERD）患者还可见食管消化性溃疡，在梅克尔憩室患者还可见回肠远端的消化性溃疡。

多数消化性溃疡患者表现为中上腹反复发作性节律性疼痛，少数患者可表现为上腹不适等消化不良症状，极少数则以呕血、黑粪、急性穿孔等为首发症状。

消化性溃疡诊断主要依赖于内镜检查和上消化道造影。内镜检查是确诊消化性溃疡的主要方法，并可通过活体组织检查协助鉴别良恶性溃疡以及幽门螺杆菌（Helicobacter pylori，Hp）的检测。上消化道造影检查可见到腔外龛影等溃疡征象。确诊后一般采取综合性治疗，目的是缓解临床症状，促进溃疡愈合，防止溃疡复发，减少并发症。无并发症的消化性溃疡患者首先采用内科治疗，包括休息、减少精神应激、消除有害环境因素、药物治疗等。对于内科治疗无效的顽固性溃疡或出现并发症的患者要考虑手术治疗。

一般药物治疗主要包括降低胃酸药、黏膜保护药、胃肠动力药等。由于胃溃疡和十二指肠溃疡在病理、生理学上存在一定差异，因此在药物治疗上应有所区别，十二指肠溃疡应主要选择降低胃内酸度的药物，胃溃疡除抑酸外还应选择增强黏膜抵抗力的药物。抑酸药首选质子泵抑制药。

除 NSAIDs 相关的消化性溃疡外，几乎所有的十二指肠溃疡和大部分胃溃疡都与 Hp 感染有关，及时根除 Hp 对促进溃疡愈合、预防溃疡复发十分重要。

近年来，NSAIDs 相关的消化性溃疡逐渐增多，而且多无症状（15% ~ 45%），溃疡并发症发生率也高（1% ~ 4%）。对于不能停用 NSAIDs 治疗者，首选质子泵抑制药治疗，也可使用 H_2 受体拮抗药或米索前列醇。

NSAIDs 和 Hp 是消化性溃疡发生的两个独立的危险因素，单纯根除 Hp 并不能减少 NSAIDs 相关溃疡的风险。但对有溃疡史的使用 NSAIDs 的患者还是推荐行 Hp 根除治疗，而且初次使用 NSAIDs 前根除 Hp 可降低 NSAIDs 溃疡的发生率。

3.1.1 抗酸药

抗酸药为碱性物质，口服后通过中和胃酸而达到降低胃酸目的，此类药物的作用特点是作用时间短，服药次数多，不良反应大，尤其对于肾功能不全患者更应引起重视。

抗酸药通常为铝、镁制剂，能够有效缓解溃疡性消化不良和 GERDs 患者的症状，有时也用于功能性消化不良。抗酸药的最佳服用时间是症状出现或将要出现时，如餐间和睡眠时间，一日 4 次或更多，最多可达一小时 1 次。传统剂量的镁 - 铝抗酸药能够促进溃疡愈合，但其效果要逊于抑酸药。

镁制剂有缓泻作用，而铝、钙制剂则可能具有便秘作用。

NSAIDs 患者同时服用抗酸药虽可以缓解症状，但会使溃疡并发症的发生风险增加 2 倍，故不推荐使用抗酸药来缓解 NSAIDs 相关症状及预防溃疡发生。

铝碳酸镁 [保（乙）]

Hydrotalcite

【适应证】(1) 急慢性胃炎。(2) 胃和十二指肠溃疡。(3) 与胃酸相关的胃部不适症状，如胃痛、胃灼热感、酸性嗳气、饱胀等。

【注意事项】(1) 心功能不全、肾功能不全、胃肠蠕动功能不良、高镁血症、高钙血症者慎用。(2) 妊娠初始 3 个月慎用。(3) 哺乳期妇女用药安全性尚不明确。

【禁忌证】对本品过敏者、胃酸缺乏者、结肠或回肠造口术、低磷血症、不明原因的胃肠出血、阑尾炎、溃疡性结肠炎、憩室炎、慢性腹泻、肠梗阻者禁用。

【不良反应】可见胃肠不适、消化不良、呕吐、腹泻。长期服用可致血清电解质变化。

【用法与用量】口服：一次 0.5～1.0 g，一日 3～4 次，两餐之间或睡前嚼服，或胃部不适时服用。

【制剂与规格】铝碳酸镁片：0.5 g。

铝碳酸镁咀嚼片：0.5 g。

铝碳酸镁颗粒：2 g：0.5 g。

铝碳酸镁悬胶液：5ml：0.5 g。

铝碳酸镁混悬液：200 ml：20 g。

氢氧化铝[基(基)，保(甲)]

Aluminium Hydroxide

【适应证】用于胃酸过多、胃及十二指肠溃疡、反流性食管炎的治疗。

【注意事项】(1) 肾功能不全、妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 长期便秘、低磷血症者慎用。(3) 服药后 1 小时内应避免服用其他药物，因氢氧化铝可与其他药物结合而降低吸收，影响疗效。

【禁忌证】对本品过敏者。阑尾炎、急腹症、早产儿和婴幼儿禁用。

【不良反应】便秘、肠梗阻；长期服用能引起低磷血症导致骨软化、骨质疏松；铝中毒，透析性痴呆。

【用法与用量】口服：①氢氧化铝凝胶，一次 5～8 ml，一日 3 次，餐前 1 小时服，病情严重时剂量可加倍。②氢氧化铝片，一次 0.6～0.9 g，一日 3 次，餐前 1 小时服。③复方氢氧化铝片，一次 2～4 片，一日 3～4 次，餐前半小时或胃痛发作时嚼碎后服用。

【制剂与规格】氢氧化铝片：0.3 g。

氢氧化铝凝胶：以氧化铝计应为 3.6%～4.4%。

复方氢氧化铝片：每片含干燥氢氧化铝 0.245 g、三硅酸镁 0.105 g、颠茄浸膏 0.002 6 g。

氧化镁

Magnesium Oxide

【适应证】(1) 治疗胃酸过多、消化性溃疡及反流性食管炎。(2) 治疗便秘。(3) 补充食物镁不足。

【注意事项】(1) 肾功能不全，可能产生滞留性中毒，如高镁血症。(2) 用药已超过 1 周肠道蠕动迟延或已趋麻痹 1～2 日者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者，严重肾功能不全、阑尾炎、急腹症、肠梗阻、溃疡性结肠炎、不明消化道出血、慢性腹泻。

【不良反应】高镁血症、低钾血症；呕吐、胃部不适、腹痛、腹泻、皮疹、皮肤瘙痒。

【用法与用量】口服：成人常用量，抗酸治疗，一次 0.2～1.0 g，一日 3 次，疗程不宜超过 2 周；缓泻治疗，一次 3 g，一日 3 次，疗程不超过 1 周。

【制剂与规格】氧化镁片：0.2 g。

氧化镁合剂：氧化镁 60 g、重质碳酸镁 60 g，蒸馏水加至 1 000 ml，抗酸药及轻泻药，一次 10 ml。

复方氧化镁合剂：氧化镁合剂加颠茄酊 60 ml，解痉镇痛，一次 10 ml。

氧化镁乳：含氢氧化镁 7.75%～8.75%，抗酸治疗一次 4 ml，轻泻一次 15 ml。

三硅酸镁

Magnesium Trisilicate

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡。

【注意事项】本品有轻泻作用。骨折患者不宜服用。低磷血症患者不宜服用。否则导致骨质疏松。

【禁忌证】见氧化镁。

【不良反应】长期服用偶可发生肾硅酸盐结石。肾功能不全患者服用可出现眩晕、晕厥、心律失常、疲乏无力等。

【用法与用量】口服：一次 0.9 g，一日 3～4 次，餐前服。

【制剂与规格】三硅酸镁片：0.3 g。

复方铝酸铋颗粒剂：每袋 1.3 g（含铝酸铋 200 mg、甘草浸膏 300 mg、碳酸镁 400 mg、碳酸氢钠 200 mg、弗朗鼠李皮 25 mg、茴香果实 10 mg）。用于：胃及十二指肠溃疡；慢性浅表性胃炎、十二指肠球炎；缓解胃酸过多引起的胃痛、胃灼热感、反酸及功能性消化不良等症状。口服：一次 1～2 袋，一日 3 次，饭后用温开水送服，疗程 1～2 个月。

3.1.2 抑酸药

抑酸药是抑制胃酸分泌的药物，是目前治疗消化性溃疡的首选药物。抑酸药通常包括 H_2 受体拮抗药和质子泵抑制药。

3.1.2.1 H_2 受体拮抗药

H_2 受体拮抗药（H_2 receptor antagonist，H_2RA）可通过阻断 H_2 受体减少胃酸分泌，尤其是可以非常有效地抑制夜间基础胃酸分泌，对促进溃疡愈合有意义。H_2RA 可减轻 GERD 患者的症状，治疗功能性消化不良，能够促进 NSAIDs 相关性溃疡的愈合，尤其是十二指肠溃疡，可能降低产科分娩患者酸误吸的风险。高剂量 H_2RA 可用于治疗卓－艾综合征，但更倾向于使用质子泵抑制药。

肾功能不全者需酌情减量，而肝功能不全者一般无需减量。

H_2RA 的耐药发生很快，而且经常发生，其机制不明。而停药引起的夜间基础胃酸反跳持续时间一般很短，往往在停药 9 日后即可消失。

西咪替丁 [保（甲）]

Cimetidine

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、吻合口溃疡、应激性溃疡、反流性食管炎、卓－艾综合征、上消化道出血。

【注意事项】对本品过敏者慎用。本品可影响某些检验数值，如肝功能；长期使用本品需定期检查肝肾功能及血象，肝肾功能不全慎用。严重心脏及呼吸系统疾病、慢性炎症、器质性脑病、幼儿、老年人、有使用本品引起血小板减少史的患者、高三酰甘油血症者慎用。本品可影响肝细胞色素 P_{450} 氧化酶系统，并影响肾小管分泌。可延缓药物的排泄，从而增加了一些合用药的血浆浓度。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肾功能不全者、妊娠及哺乳期妇女；急性胰腺炎。

【不良反应】皮疹、荨麻疹；头痛、头晕、乏力、幻觉；口干、恶心、呕吐、便秘、腹泻、轻度 AST 及 ALT 增高；罕见腹部胀满感及食欲缺乏；偶见白细胞减少；罕见心率增加，血压上升；罕见耳鸣、面部潮红、月经不调；胃内细菌繁殖、感染；突发性心律失常、心动过缓、心源性休克及轻度的房室传导阻滞、心搏骤停；维生素 B_{12} 缺乏、男性乳房女性化、女性溢乳、性欲减退、阳痿、急性血卟啉病；视物模糊；关节痛、肌痛；肾功能损伤。

【用法与用量】(1) 成人常规剂量：①口服。十二指肠溃疡或病理性高分泌状态一次 200 ～ 400 mg，一日 2 ～ 4 次，或 800 mg 睡前一次服用，疗程 4 ～ 6 周；治疗卓－艾综合征时一次 400 mg，一日 4 次。预防溃疡复发一次 400 mg，睡前服用。反流性食管炎一日 800 mg，睡前服用，疗程 4 ～ 8 周，必要时可延长 4 周。反流性食管炎的对症治疗最大剂量一次 200 mg，一日 3 次，疗程不得超过 2 周。②肌内注射，一次 200 mg，每 6 小时 1 次。③静脉注射，将本品用葡萄糖注射液或葡萄糖氯化钠注射液 20 ml 稀释后缓慢静脉注射（长于 5 分钟），一次 200 mg，每 4 ～ 6 小时 1 次，一日剂量不宜超过 2 g。④静脉滴注，将本品用葡萄糖注射液或葡萄糖氯化钠注射液稀释后静脉滴注，一次 200 ～ 600 mg，一日剂量不宜超过 2 g。(2) 肾功能不全者应减量：①肌酐清除率为每分钟 30 ～ 50 ml 时，一次 200 mg，每 6 小时 1 次；②肌酐清除率为每分钟 15 ～ 30 ml 时，剂量为一次 200 mg，每 8 小时 1 次；③肌酐清除率小于每分钟 15 ml 时，剂量为一次 200 mg，每 12 小时 1 次。(3) 肝功能不全者：最大剂量为一日 600 mg。(4) 老年人：剂量酌减。

【制剂与规格】西咪替丁片：① 200 mg；② 400 mg；③ 800 mg。

西咪替丁胶囊：200 mg。

西咪替丁注射液：2 ml : 200 mg。

雷尼替丁 [基（基），保（甲）]

Ranitidine

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、吻合口溃疡、应激性溃疡、反流性食管炎、卓－艾综合征、上消化道出血。

【注意事项】(1) 本品可影响某些检验值，如肝功能。(2) 长期使用本品需定期检查肝肾功能及血象。(3) 肝肾功能不

全慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 严重肾功能不全者。(3) 妊娠及哺乳期妇女。(4) 8岁以下儿童。(5) 苯丙酮尿症者。(6) 急性间歇性血卟啉病。

【不良反应】见西咪替丁。

【用法与用量】(1) 成人常规剂量：①口服：用于消化性溃疡急性期一次150 mg，一日2次，早晚餐时服，或300 mg睡前顿服，疗程4～8周，如需要可治疗12周；维持治疗一日150 mg，夜间顿服，疗程1年以上；用于NSAIDs相关胃黏膜损伤急性期一次150 mg，一日2次，或300 mg夜间顿服，疗程8～12周；预防用药一次150 mg，一日2次，或300 mg夜间顿服；用于反流性食管炎一次150 mg，一日2次，或300 mg夜间顿服，疗程8～12周，中度至重度食管炎剂量可增加至一次150 mg，一日4次，疗程12周，维持治疗一次150 mg，一日2次；卓-艾综合征宜用大量，一日600～1 200 mg；间歇性发作性消化不良一次150 mg，一日2次，疗程6周；重症患者的应激性溃疡出血或消化性溃疡反复出血预防一次150 mg，一日2次，以代替注射给药；Mendelcon综合征预防，手术患者麻醉前2小时服150 mg，最好麻醉前一日晚上服150 mg；分娩患者一次150 mg，每6小时1次，如需要全身麻醉，应另外给予非颗粒的抗酸药（如枸橼酸钠）。②肌内注射：溃疡病出血一次25～50 mg，每4～8小时1次。③静脉注射：将本品注射液50 mg用0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖稀释至20 ml，做缓慢静脉注射（超过2分钟），消化性溃疡出血一次25～50 mg，每4～8小时1次。术前用药于术前1.5小时静脉注射100 mg。④静脉滴注：消化性溃疡出血以每小时25 mg的速率间歇静脉滴注2小时，一日2次或每6～8小时1次；术前用药，加入5%葡萄糖注射液100 ml，静脉滴注100～300 mg，30分钟滴完。(2) 肾功能不全者：严重肾功能损坏患者（肌酐清除率<50 ml/min），口服剂量一次75 mg，一日2次；注射推荐剂量25 mg。(3) 肝功能不全者：剂量应减少。老年人的肝肾功能降低，为保证用药安全，剂量应进行调整。长期非卧床腹透或长期血透的患者，于透析后应立即口服150 mg。

【制剂与规格】雷尼替丁片：① 150 mg；② 300 mg。

雷尼替丁胶囊：150 mg。

雷尼替丁注射液：① 2 ml : 50 mg；② 100 ml : 100 mg；③ 5 ml : 50 mg；④ 100 mg冻干粉。

法莫替丁 [基(基)，保(甲)]

Famotidine

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、吻合口溃疡、应激性溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、上消化道出血。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者、老年人、心脏病患者慎用。(2) 小儿用药的安全性尚未确定。(3) 胃溃疡患者应先排除胃癌后才使用。(4) 用药期间可能出现中性粒细胞和血小板计数减少。(5) 长期使用应定期监测肝肾功能及血象。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肾功能不全者、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】皮疹、荨麻疹；头痛、头晕、乏力、幻觉；口干、恶心、呕吐、便秘、腹泻、轻度ALT及AST增高、罕见腹部胀满感及食欲缺乏；偶见白细胞减少；罕见心率增加，血压上升；罕见耳鸣、面部潮红、月经不调。

【用法与用量】(1) 成人常规剂量：口服：①活动性胃十二指肠溃疡，一次20 mg，一日2次，早晚服用，或睡前一次服用40 mg，疗程4～6周。十二指肠溃疡的维持治疗或预防复发，一日20 mg，睡前顿服。反流性食管炎，Ⅰ、Ⅱ度一日20 mg，Ⅲ、Ⅳ度一日40 mg，分2次于早晚餐后服用，疗程4～8周。卓-艾综合征，初始剂量一次20 mg，每6小时1次，以后可根据病情相应调整剂量。②静脉注射：消化性溃疡出血或应激性溃疡出血，一次20 mg，每12小时1次，一次不能超过20 mg，把药物溶解于0.9%的氯化钠溶液5～10 ml中，然后缓慢注射（至少2分钟）。③静脉滴注：剂量同静脉注射，应把本品溶解于5%葡萄糖溶液100 ml中，滴注时间为15～30分钟。

(2) 肾功能不全者：应酌情减量或延长用药间隔时间。肌酐清除率≤30 ml/min时，可予一日20 mg，睡前顿服。(3) 老年人：剂量酌减。

【制剂与规格】法莫替丁片：① 10 mg；② 20 mg；③ 40 mg。

法莫替丁胶囊：20 mg。

法莫替丁散剂：10%。

法莫替丁注射液：2 ml∶20 mg。

尼扎替丁

Nizatidine

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、吻合口溃疡、应激性溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、上消化道出血。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用。(2) 本品不建议儿童使用。(3) 治疗之前先排除胃恶性肿瘤后方可使用。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肾功能不全者、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】见法莫替丁。

【用法与用量】口服：(1) 成人常规剂量：①活动性十二指肠溃疡，一日300 mg，睡前顿服，或一次150 mg，一日2次；②良性溃疡，一日300 mg，睡前顿服；③预防十二指肠溃疡复发，一日150 mg，睡前顿服。(2) 肾功能不全者，酌情减量。

【制剂与规格】尼扎替丁胶囊：① 150 mg；② 300 mg。

尼扎替丁片：150 mg。

罗沙替丁乙酸酯

Roxatidine Acetate

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、吻合口溃疡、应激性溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、上消化道出血。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用。(2) 孕妇和儿童用药的安全性尚未明确，一般不宜应用。

【不良反应】见法莫替丁。

【禁忌证】对本品过敏者、哺乳期妇女禁用。

【用法与用量】(1) 成人常规剂量：口服，一次75 mg，一日2次，早餐后及睡前服用。可按照年龄和症状适当增减。(2) 肝肾功能不全者：酌情减量。

【制剂与规格】罗沙替丁乙酸酯缓释胶囊：75 mg。

枸橼酸铋雷尼替丁

Ranitidine Bismuth Citrate

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、吻合口溃疡、应激性溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、上消化道出血。

【注意事项】(1) 对儿童不建议使用。(2) 服用本品后可见粪便变黑、舌发黑，属正常现象。(3) 不宜长期大剂量、连续使用，疗程不宜超过6周。

【禁忌证】对枸橼酸铋雷尼替丁或其任何成分过敏者、重度肾功能损害者禁用。孕妇和哺乳期妇女禁用。

【不良反应】常见肝功能（ALT及AST）异常、恶心、腹痛、腹部不适、腹泻及便秘，偶有头痛或关节痛，罕见皮肤瘙痒、皮疹、粒细胞减少。

【用法与用量】口服：一次0.35～0.4 g，一日2次，餐前服用，疗程不宜超过6周。与抗菌药合用的剂量和疗程应遵医嘱。

【制剂与规格】枸橼酸铋雷尼替丁胶囊：0.35 g。

枸橼酸铋雷尼替丁片：0.4 g。

3.1.2.2 质子泵抑制药

质子泵抑制药（proton pump inhibitor，PPI）通过阻断胃腺壁细胞上的质子泵而抑制胃酸分泌。PPI是有效的胃十二指肠溃疡短期治疗药物，还可与抗菌药物联合应用于Hp的根除治疗。PPI能够用于治疗消化不良和GERD，预防、治疗NSAIDs相关性溃疡。对于溃疡治愈后需要继续NSAIDs治疗的患者，PPI不能减量，以防无症状性溃疡的发生、加重。PPI可用于控制卓-艾综合征患者胃酸的过度分泌，而且通常需要较大剂量。

PPI应在餐前立即服用。PPI很少发生耐药现象，但停药后引起的基础胃酸和最大胃酸分泌反弹持续时间则较长，可达2个月。

奥美拉唑[基(基).保(甲/乙)]

Omeprazole

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、消化性溃疡急性出血、急性胃黏膜病变出血，与抗生素联合用于Hp根除治疗。

【注意事项】(1)药物可对诊断产生影响，使血中促胃液素水平升高，^{13}C-尿素呼气试验(UBT)假阴性。(2)用药前后及用药时应当检查或监测的项目：内镜检查了解溃疡是否愈合，UBT试验了解Hp是否已被根除，基础胃酸分泌检查了解治疗卓-艾综合征的效果，肝功能检查，长期服用者定期检查胃黏膜有无肿瘤样增生，用药超过3年者监测血清维生素B_{12}水平。(3)首先排除癌症的可能后才能使用本品。(4)不宜再服用其他抗酸药或抑酸药。(5)老年人使用本品不需要调整剂量。(6)肝肾功能不全慎用。(7)妊娠及哺乳期妇女尽可能不用。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肾功能不全者、婴幼儿禁用。

【不良反应】口干、轻度恶心、呕吐、腹胀、便秘、腹泻、腹痛、ALT及AST升高、胆红素升高，萎缩性胃炎；感觉异常、头晕、头痛、嗜睡、失眠、外周神经炎；维生素B_{12}缺乏；致癌性，如肠嗜铬细胞增生、胃部类癌；皮疹、男性乳房发育、溶血性贫血。

【用法与用量】成人常规剂量：(1)口服：本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。①用于胃、十二指肠溃疡，一次20 mg，清晨顿服，十二指肠溃疡疗程2～4周，胃溃疡疗程4～8周；②用于难治性消化性溃疡，一次20 mg，一日2次，或一次40 mg，一日1次；③用于反流性食管炎，一日20～60 mg，晨起顿服或早、晚各1次，疗程4～8周；④用于卓-艾综合征，初始剂量为一次60 mg，一日1次，以后酌情调整为一日20～120 mg，如剂量大于一日80 mg，则应分两次给药，其疗程视临床情况而定。(2)静脉注射：消化性溃疡出血，一次40 mg，每12小时1次，连续3日。首次剂量可加倍，先把10 ml专用溶剂完全抽出，然后打进有冻干药物的小瓶内，溶化后即组成静脉注射液，应在4小时内使用，注射速度不宜过快(每40 mg不可少于2.5分钟)。(3)静脉滴注：出血量大时可用首剂80 mg静脉滴注，之后改为每小时8 mg维持，至出血停止，将专用溶剂注入冻干粉小瓶内溶解药物后加入氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液100 ml，40 mg奥美拉唑稀释后滴注时间不少于20分钟。对严重肝功能不全者慎用，必要时剂量减半。

【制剂与规格】奥美拉唑片：①10 mg；②20 mg。

奥美拉唑缓释胶囊：①10 mg；②20 mg。

奥美拉唑镁肠溶片：①10 mg；②20 mg。

奥美拉唑肠溶胶囊：20 mg。

注射用奥美拉唑钠：40 mg。

埃索美拉唑[保(乙)]

Esomeprazole

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、消化性溃疡急性出血、急性胃黏膜病变出血，与抗生素联合用于Hp根除治疗。

【注意事项】见奥美拉唑。

【不良反应】见奥美拉唑。

【禁忌证】对本品、奥美拉唑或其他苯并咪唑类化合物过敏者，哺乳期妇女、儿童禁用。

【用法与用量】(1)成人常规剂量。口服：本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。①糜烂性食管炎一次40 mg，一日1次，疗程4周，如食管炎未治愈或症状持续的患者建议再治疗4周；②食管炎维持治疗一次20 mg，一日1次；GERD，一次20 mg，一日1次，如果用药4周后症状未得到控制，应对患者进一步检查，一旦症状消除，即按需治疗；③Hp根除见3.2.1。(2)肾功能不全者无需调整剂量。轻、中度肝功能损害的患者无需调整剂量，严重肝功能损害的患者，本品一日剂量不应超过20 mg。老年人无需调整剂量。

【制剂与规格】埃索美拉唑镁肠溶片：①20 mg；②40 mg。

注射用埃索美拉唑钠：40 mg。

兰索拉唑[保(乙)]

Lansoprazole

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、消化性溃疡急性出血、急性胃黏膜病变出血，与抗生素联合用于Hp根除治疗。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全慎用。(2) 妊娠期妇女慎用。(3) 小儿不宜使用。(4) 老年人慎用。(5) 首先排除癌症的可能后才能使用本品。不宜再服用其他抗酸药或抑酸药。

【不良反应】见奥美拉唑。

【禁忌证】对本品过敏者。哺乳期妇女禁用。

【用法与用量】(1) 成人常规剂量：口服。本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。①用于胃及十二指肠溃疡，一次15～30 mg，一日1次，于清晨口服，十二指肠溃疡疗程4周，胃溃疡为4～6周，反流性食管炎为8～10周；②用于卓-艾综合征，因人而异，可加大至一日120 mg。(2) 肝肾功能不全者：口服，一次15 mg，一日1次。

【制剂与规格】兰索拉唑肠溶片：① 15 mg；② 30 mg。

兰索拉唑肠溶胶囊：① 15 mg；② 30 mg。

泮托拉唑[保(乙)]

Pantoprazole

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、消化性溃疡急性出血、急性胃黏膜病变出血，与抗生素联合用于Hp根除治疗。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用，严重肝功能损害的应减少剂量并定期测定肝脏酶谱的变化。(2) 儿童不宜应用。(3) 用前需排除胃与食管的恶性病变，以免因症状缓解而延误诊断。

【不良反应】见奥美拉唑。

【禁忌证】对本品过敏者、哺乳期、妊娠期妇女禁用。

【用法与用量】(1) 口服：本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。①成人常规剂量，一次40 mg，一日1次，早餐前服用，十二指肠溃疡疗程2～4周，胃溃疡及反流性食管炎疗程4～8周；治疗Hp感染参见3.2.1。②肾功能不全者，剂量不宜超过一日40 mg。③肝功能不全者，严重肝衰竭患者，剂量应减少至隔日40 mg。④老年人，剂量不宜超过一日40 mg，在根除Hp治疗时参照常规剂量。(2) 静脉滴注：一日1次，一次40 mg，疗程根据临床需要酌情掌握，但通常不超过8周。将0.9%氯化钠注射液10 ml注入装有泮托拉唑干燥物的小瓶中制成待用液，此液可直接静脉输入（至少持续2分钟），或将之与100 ml，0.9%氯化钠注射液100 ml、5%或10%的葡萄糖注射液100 ml混合后静脉输入（时间为15～30分钟），不宜用上述之外的液体配制，配制液的pH为9。配制液需在3小时内使用。

【制剂与规格】泮托拉唑钠肠溶片：40 mg。

泮托拉唑钠肠溶胶囊：40 mg。

注射用泮托拉唑钠：① 40 mg；② 80 mg。

雷贝拉唑钠[保(乙)]

Rabeprazole Sodium

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、反流性食管炎、卓-艾综合征、消化性溃疡急性出血、急性胃黏膜病变出血，与抗生素联合用于Hp根除治疗。

【不良反应】见奥美拉唑。

【注意事项】(1) 肝脏疾病慎用。(2) 老年人慎用。(3) 定期进行血液生化、甲状腺功能检查。(4) 应在排除恶性肿瘤的前提下再行给药。(5) 不宜用于维持治疗。(6) 长期治疗患者应定期进行检测。

【禁忌证】对本品及其成分过敏史者、有苯并咪唑类药物过敏史者、妊娠及哺乳期妇女、儿童禁用。

【用法与用量】(1) 成人常规剂量：口服。本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。①用于活动性十二指肠溃疡，一次10～20 mg，一日1次，早晨服用，疗程4～8周；②活动性胃溃疡，一次20 mg，一日1次，早晨服用，疗程6～12周。(2) 胃食管反流病，一次20 mg，一日1次，早晨服用，疗程4～8周。(3) 重症肝炎

患者应慎用本品，必须使用时应从小剂量开始并监测肝功能。肝功能正常的老年人无需调整剂量。

【制剂与规格】雷贝拉唑钠胶囊：20 mg。雷贝拉唑钠肠溶片：① 10 mg；② 20 mg。

艾普拉唑

Ilaprazole

【适应证】用于治疗十二指肠溃疡。

【注意事项】(1) 本品不能咀嚼或压碎，应整片吞服。(2) 本品抑制胃酸分泌作用强，对于一般消化性溃疡等疾病，不宜长期大剂量服用。(3) 使用前应先排除胃与食管的恶性病变，以免因症状缓解而延误诊断。(4) 目前尚无妊娠及哺乳期妇女使用本品的临床试验资料，不建议妊娠及哺乳期妇女服用。若哺乳期妇女必须用药时，应暂停哺乳。(5) 老年患者的胃酸分泌能力和其他生理功能均会降低，应慎重用药。

【禁忌证】对艾普拉唑及其他苯并咪唑类化合物过敏者，肝、肾功能不全者禁用。婴幼儿禁用。

【不良反应】常见腹泻、头晕、头痛、ALT 及 AST 升高；少见皮疹、荨麻疹、腰痛、腹胀、口干、口苦、胸闷、心悸、月经时间延长、肾功能异常（蛋白尿、BUN 升高）、心电图异常（室性期前收缩、I 度房室传导阻滞）、白细胞计数减少等。上述不良反应常为轻、中度，可自行恢复。

【用法与用量】口服：用于成人十二指肠溃疡，一次 10 mg，一日 1 次，每日晨起空腹吞服（不可咀嚼），疗程 4 周，或遵医嘱。

【制剂与规格】艾普拉唑肠溶片：5 mg。

3.1.2.3 其他抑酸药

主要是抗毒蕈碱类和抗胃泌素类，如盐酸哌仑西平。抗胃泌素类有降低胃酸分泌的作用，而抗毒蕈碱类不仅可以抑制胃酸，而且可以抑制胃蛋白酶分泌，更有意义的是其可以降低胃蠕动，减慢胃的排空，因而适于治疗十二指肠溃疡，以减轻疼痛并增加抗酸药的中和效能，但不宜用于治疗胃溃疡。

哌仑西平

Pirenzepine

【适应证】用于胃和十二指肠溃疡、应激性溃疡、急性胃黏膜出血、胃食管反流病及胃泌素瘤等。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用。(2) 本品在哺乳期妇女乳汁中有少量存在，应用时需权衡利弊。(3) 儿童慎用。(4) 心血管疾病者慎用，应避免高剂量用药。

【不良反应】有轻度口干、眼睛干燥及视力调节障碍等。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠期妇女、青光眼和前列腺增生者禁用。

【用法与用量】(1) 口服：成人，一次 50～75 mg，一日 2 次，于早、晚餐前 1.5 小时（或更长时间）服用。或一次 50 mg，一日 3 次，于餐前空腹时服用。疗程 4～6 周。(2) 静脉注射或肌内注射：成人，一次 10 mg，一日 2 次，好转后改为口服给药。

【制剂与规格】盐酸哌仑西平片：① 25 mg；② 50 mg。

盐酸哌仑西平注射液：2 ml : 10 mg。

3.1.3 黏膜保护药

胃黏膜保护药是指预防和治疗胃黏膜损伤，保护胃黏膜，促进组织修复和溃疡愈合的药物。胃黏膜保护药品种繁多，有的胃黏膜保护药还同时兼有抗酸作用，如碱式碳酸铋，有的兼有杀灭 Hp 的作用，如胶体铋剂。

吉法酯[保(乙)]

Gefarnate

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、急慢性胃炎、空肠溃疡及痉挛、胃酸过多、胃灼热、腹胀、消化不良。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女慎用。(2) 有前列腺素类药物禁忌者，如青光眼患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠期妇女禁用。

【不良反应】口干、恶心、心悸、便秘。

【用法与用量】(1) 成人常用量：口

服。①一次 100 mg，一日 3 次，疗程 1 个月，病情严重者需 2 ~ 3 个月；②维持治疗，一次 50 ~ 100 mg，一日 3 次；③预防性用药，一次 50 mg，一日 3 次。(2) 肝、肾功能不全者：口服，一次 50 ~ 100 mg，一日 2 ~ 3 次。(3) 透析者：一次 50 ~ 100 mg，一日 2 ~ 3 次。(4) 老年人：剂量酌减。

【制剂与规格】吉法酯片：50 mg。

硫糖铝 [保(乙)]

Sucralfate

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、胃炎。

【注意事项】(1) 肾功能不全慎用。(2) 妊娠期妇女不宜服用。(3) 哺乳期妇女不宜服用。(4) 应复查溃疡愈合情况。(5) 用药期间监测血清铝浓度。(6) 甲状腺功能亢进、低磷血症患者不宜长期用药。(7) 本品对严重十二指肠溃疡效果较差。

【禁忌证】对本品过敏者、早产儿及未成熟的新生儿禁用。

【不良反应】常见便秘；少见口干、恶心、呕吐、腹泻、皮疹、眩晕、瘙痒、低磷血症、骨软化。

【用法与用量】口服：①用于活动性胃、十二指肠溃疡，一次 1 g，一日 3 ~ 4 次，餐前 1 小时及睡前服用，疗程 4 ~ 6 周；②预防十二指肠溃疡复发，一次 1 g，一日 2 次，餐前 1 小时及睡前服用。

【制剂与规格】硫糖铝片：① 0.25 g；② 0.5 g。

硫糖铝胶囊：0.25 g。

硫糖铝混悬剂：① 5 ml : 1 g；② 10 ml : 1 g；③ 200 ml : 20 g。

枸橼酸铋钾 [基(基)，保(甲/乙)]

Bismuth Potassium Citrate

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、急慢性胃炎、Hp 感染的根除治疗。

【注意事项】(1) 肝功能不全慎用。(2) 儿童慎用。(3) 急性胃黏膜病慎用。(4) 不得服用其他铋制剂，连续用药不宜超过 2 个月，停用含铋药物 2 个月，可再继续下一个疗程。(5) 服药时不得同时食用高蛋白饮食。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠及哺乳期妇女、严重肾功能不全者禁用。

【不良反应】口中氨味、舌苔及大便呈灰黑色、恶心、呕吐、食欲减退、腹泻、便秘；头痛、头晕、失眠、长期大剂量服用可导致铋性脑病；肾毒性；铋性脑病相关的骨关节病；皮疹。

【用法与用量】口服，一次 1 包（或 1 粒，含铋 0.11 g），一日 4 次，前 3 次于三餐餐前半小时、第 4 次于晚餐后 2 小时服用，或一日 2 次，早晚各服 2 包（或 2 粒，含铋 0.22 g），疗程 4 周，如再继续服用，应遵医嘱。

【制剂与规格】枸橼酸铋钾颗粒：① 1.0 g（含铋 0.11 g）；② 1.2 g（含铋 0.11 g）。

枸橼酸铋钾胶囊：0.3 g（含铋 0.11 g）。

胶体果胶铋 [保(乙)]

Colloidal Bismuth Pectin

【适应证】(1) 治疗胃溃疡，十二指肠溃疡。(2) 急慢性胃炎。(3) Hp 感染的根除治疗。

【注意事项】服药期间粪便可呈无光泽的黑褐色。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肾功能不全患者、妊娠期妇女禁用。

【不良反应】便秘。

【用法与用量】口服：用于消化性溃疡和慢性胃炎，一次 120 ~ 150 mg（以铋计），一日 4 次，分别于三餐前 1 小时及临睡时服用，疗程 4 周；并发消化道出血者，将胶囊内药物取出，用水冲开搅匀后服用，将日服剂量一次服用。

【制剂与规格】胶体果胶铋胶囊（以铋计）：① 40 mg；② 50 mg。

替普瑞酮 [保(乙)]

Teprenone

【适应证】用于各种原因引起的急慢性胃炎、胃黏膜病变的改善及胃溃疡。

【注意事项】(1) 妊娠期用药的安全性尚未确定，妊娠期妇女应慎用。(2) 儿童用药的安全性尚未确定，儿童应慎用。(3) 出现皮疹、全身瘙痒等皮肤症状时，应停止用药。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】本品所致的不良反应发生率约为2.22%，一般停药后即可消失。(1)消化系统：可出现便秘、腹胀、腹泻、口渴、恶心、腹痛等症状，也可出现ALT及AST轻度升高。(2)精神神经系统：可出现头痛等症状。(3)皮肤：可出现皮疹、全身瘙痒等症状。(4)其他：有时会出现血清总胆固醇升高、上睑发红或发热等症状。

【用法与用量】口服：成人常规剂量，一次50 mg，一日3次，餐后30分钟服用。可根据年龄、症状酌情适当增减。

【制剂与规格】替普瑞酮胶囊：50 mg。

瑞巴派特[保(乙)]

Rebamipide

【适应证】用于胃溃疡。急性胃炎、慢性胃炎的急性加重期胃黏膜病变(糜烂、出血、充血、水肿)的改善。

【注意事项】(1)用于妊娠期妇女时，须认真权衡利弊；哺乳妇女在服用期间应暂停哺乳。(2)老年患者慎用；对儿童的安全性尚未确定。(3)服药期间若出现瘙痒、皮疹或湿疹等过敏反应时，应即停药。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】可见腹胀、便秘、口渴、头晕、恶心、呕吐、胃灼热、嗳气、腹痛、腹泻、喉部异物感、肝功能异常、BUN升高、乳房肿胀、溢乳、月经紊乱及过敏症状(瘙痒、皮疹、湿疹)等。

【用法与用量】口服：(1)用于胃溃疡，成人一次100 mg，一日3次。(2)急性胃炎、慢性胃炎的急性加重期胃黏膜病变(糜烂、出血、充血、水肿)的改善，成人一次100 mg，一日3次。

【制剂与规格】瑞巴派特片：100 mg。

米索前列醇[保(乙)]

Misoprostol

【适应证】用于胃及十二指肠溃疡、急慢性胃炎、空肠溃疡及痉挛，胃酸过多、胃灼热、腹胀、消化不良。

【注意事项】脑血管或冠状动脉病变的患者、低血压者、癫痫患者慎用。可引起腹泻。妇女使用米索前列醇治疗开始前2周内血清妊娠试验必须是阴性，用药期间妇女必须使用有效的避孕方法；若怀疑妊娠，应立即停用米索前列醇。

【禁忌证】对前列腺素类过敏者禁用；青光眼、哮喘、过敏性结肠炎及过敏体质等禁用，有心、肝、肾或肾上腺皮质功能不全者禁用。妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】腹泻、腹痛、消化不良、肠胀气、恶心及呕吐；月经过多、阴道出血、经期前后阴道出血；皮肤瘙痒，偶有眩晕、头痛；倦怠、震颤、惊厥、呼吸困难、发热、心悸、低血压、心动过缓。

【用法与用量】口服：用于胃及十二指肠溃疡，一次200 μg，一日4次，于3餐前和睡前服用，疗程4～8周，如溃疡复发可继续延长疗程；预防非甾体抗炎药相关消化性溃疡，一次200 μg，一日2～4次。

【制剂与规格】米索前列醇片：200 μg。

3.1.4 胃肠动力药

消化性溃疡患者存在胃动力异常，十二指肠溃疡时胃排空增快，而胃溃疡时多有胃排空延缓，而且胃溃疡患者多合并十二指肠胃反流。因此不同部位(十二指肠／胃)的消化性溃疡应该选择不同类型(抑动力／促动力)的胃肠动力药。

3.1.4.1 解痉药

抑制胃肠动力药主要为M受体拮抗药，包括颠茄生物碱类及其衍生物和大量人工合成代用品。该类药物在消化道运动方面的作用机制包括：减弱食管、胃和小肠的蠕动，松弛下食管括约肌、幽门及胆道口(Oddi)括约肌，从而减慢胃的排空和小肠转运；减弱胆囊的收缩和减低胆内压力；减弱结肠的蠕动，减慢结肠内容物的转运。目前临床上使用的解痉药以抗胆碱药物为主，多为非特异性受体拮抗药。

阿托品[基(基)，保(甲)]

Atropine

【适应证】(1)各种内脏绞痛，如胃肠绞痛及膀胱刺激症状。对胆绞痛、肾绞

痛的疗效较差。(2) 全身麻醉前给药，严重盗汗和流涎症。(3) 迷走神经过度兴奋所致的窦房阻滞，房室阻滞等缓慢性的心律失常。(4) 抗休克。(5) 解救有机磷酸酯类农药中毒。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女：可分泌入乳汁，并有抑制泌乳的作用。(2) 妊娠：静脉注射本品可使胎儿心动过速。(3) 儿童用药：婴幼儿对本品的毒性反应极其敏感，特别是痉挛性麻痹与脑损伤的儿童，反应更强，环境温度较高时，因闭汗有体温急骤升高的危险，应用时要严密观察。(4) 老年人用药：老年人容易发生抗 M 胆碱样不良反应，如排尿困难、便秘、口干（特别是男性），也易诱发未经诊断的青光眼，一经发现，应即停药。本品对老年人尤易致汗液分泌减少，影响散热，故夏天慎用。(5) 下列情况应慎用：脑损害者（尤其是儿童）、心脏病（特别使心律失常、充血性心力衰竭、冠心病、二尖瓣狭窄等）、反流性食管炎、溃疡性结肠炎。(6) 其他：对其他颠茄生物碱不耐受者，对本品也不耐受。

【禁忌证】青光眼及前列腺增生者、高热者禁用。

【不良反应】常见便秘、出汗减少、口鼻咽喉干燥、视物模糊、皮肤潮红、排尿困难、胃肠动力减退、胃食管反流；少见眼压升高、过敏性皮疹、疱疹；接触性药物性眼睑结膜炎。

【用法与用量】(1) 成人：①口服：一次 0.3 ~ 0.6 mg，一日 3 次，极量一次 1 mg 或一日 3 mg。②皮下注射、肌内注射、静脉注射：一般用药，一次 0.3 ~ 0.5 mg，一日 0.5 ~ 3 mg，极量一次 2 mg。③麻醉前用药：术前 0.5 ~ 1 小时，肌内注射 0.5 mg。④抗心律失常，静脉注射 0.5~1 mg，按需可 1~2 小时 1 次，最大剂量为 2 mg。⑤抗休克及改善微循环，一般按体重 0.02 ~ 0.05 mg/kg，用 5% 的葡萄糖注射液稀释后静脉注射。⑥有机磷中毒时，肌内注射和静脉注射 1 ~ 2 mg（严重有机磷中毒时剂量可加大 5 ~ 10 倍），每 10 ~ 20 分钟重复，直到青紫消失，病情稳定，然后用维持量。(2) 儿童：①口服给药：按体重 0.01 mg/kg，每 4 ~ 6 小时 1 次。②静脉注射：儿童耐受性差，0.2 ~ 10 mg 可中毒致死。

【制剂与规格】阿托品片：0.3 mg（以硫酸阿托品计，下同）。

阿托品注射液：① 1 ml：0.5 mg；② 1 ml：1 mg；③ 1 ml：5 mg；④ 5 ml：25 mg。

颠茄 [基(基)，保(甲)]

Belladonna

【适应证】胃及十二指肠溃疡，轻度胃肠平滑肌痉挛等，胆绞痛，输尿管结石腹痛，胃炎及胃痉挛引起的呕吐和腹泻，迷走神经兴奋导致的多汗、流涎、心率慢、头晕等。

【注意事项】不能和促动力药合用。酊剂浓度剂量不可过大，以免发生阿托品化现象。

【禁忌证】青光眼、前列腺增生、心动过速患者禁用。

【不良反应】可见口干、少汗、瞳孔轻度扩大、排尿困难、皮肤潮红、干燥、呼吸道分泌物减少、痰黏、腹胀、便秘、心悸、视物模糊、头晕、神志不清、谵妄、躁动、幻觉。

【用法与用量】口服：①颠茄酊剂，一次 0.3 ~ 1.0 ml，极量一次 1.5 ml，一日 3 次。②颠茄浸膏，一次 8 ~ 16 mg。极量一次 50 mg。③颠茄片，成人一次 10 mg，必要时 4 小时可重复一次。④复方颠茄片，一次 1 片。

【制剂与规格】颠茄酊：0.03%（以生物碱计）。

颠茄浸膏：1%。(以生物碱计)。

颠茄片：10 mg。

复方颠茄片：含颠茄浸膏 0.01 g、苯巴比妥 0.015 g。

溴丙胺太林 [保(乙)]

Propantheline Bromide

【适应证】用于胃肠痉挛性疼痛。

【注意事项】(1) 心脏病、肝功能损害、高血压、呼吸道疾病等患者、妊娠期妇女及老年人慎用。(2) 儿童应在医师指导下使用。

【禁忌证】出血性疾病及术前、尿潴

留、前列腺肥大、青光眼患者及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】常见口干、面部潮红、视物模糊、尿潴留、便秘、头痛、心悸等，减量或停药后可消失。

【用法与用量】口服：成人一次15 mg，疼痛时服。必要时4小时后可重复1次。

【制剂与规格】溴丙胺太林片：15 mg。

山莨菪碱[基(基)，保(甲)]

Anisodamine

【适应证】用于感染中毒性休克、血管痉挛和栓塞引起的循环障碍、解除平滑肌痉挛、胃肠绞痛、胆道痉挛、有机磷中毒。

【注意事项】(1) 婴幼儿、老年体虚者慎用。(2) 急腹症未明确诊断时，不宜轻易使用。(3)夏季用药时，因其闭汗作用，可使体温升高。(4) 反流性食管炎，重症溃疡性的结肠炎慎用。

【禁忌证】颅内压增高、脑出血急性期、青光眼、前列腺增生，新鲜眼底出血、幽门梗阻、肠梗阻，恶性肿瘤者。

【不良反应】口干、面部潮红、轻度扩瞳、视近物模糊；心率加快、排尿困难，阿托品样中毒症状。

【用法与用量】(1) 口服：一次5 ~ 10 mg，一日3次。(2) 肌内注射：一般慢性疾病，成人一次5 ~ 10 mg，小儿0.1 ~ 0.2 mg/kg。(3) 静脉注射：用于抗休克及有机磷中毒，成人一次10 ~ 40 mg，必要时每隔10 ~ 30分钟重复给药，也可增加剂量，病情好转时逐渐延长给药间隔，直至停药。

【制剂与规格】氢溴酸山莨菪碱片：① 5 mg；② 10 mg。

氢溴酸山莨菪碱注射液：① 1 ml ∶ 5 mg；② 1 ml ∶ 10 mg；③ 1 ml ∶ 20 mg。

东莨菪碱[保(乙)]

Scopolamine

【适应证】(1) 胃肠道痉挛、胆绞痛、肾绞痛、胃肠道蠕动亢进。(2) 内镜检查的术前准备、内镜逆行胰胆管造影、气钡双重造影、腹部CT扫描的术前准备。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 老年患者慎用。(3) 婴幼儿与低血压患者慎用。(4) 不宜用于因胃张力低下和胃运动障碍及胃食管反流所引起的上腹痛、胃灼热等症状。(5) 忌与碱性药液配伍使用。

【禁忌证】严重心脏病、器质性幽门狭窄、麻痹性肠梗阻、青光眼，前列腺增生。

【不良反应】口渴、视力调节障碍、嗜睡、心悸、面部潮红、恶心、呕吐、眩晕、头痛、胃食管反流、过敏反应、排尿困难、精神失常。

【用法与用量】(1) 口服：①一次10 ~ 20 mg，一日3 ~ 5次，应整片或整粒吞服（片剂、胶囊剂）；②一次10 mg，一日3 ~ 5次（溶液剂）。(2) 肌内注射：一次20 ~ 40 mg，或一次20 mg，间隔20 ~ 30分钟后再用20 mg；急性绞痛发作一次20 mg，一日数次。(3) 静脉注射：一次20 ~ 40 mg，或一次用20 mg间隔20 ~ 30分钟后再用20 mg；急性绞痛发作一次20 mg，一日数次，速度不宜过快。(4) 静脉滴注：一次20 ~ 40 mg，或一次用20 mg间隔20 ~ 30分钟后再用20 mg；急性绞痛发作一次20 mg，一日数次，将本品溶于5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液中静脉滴注。

【制剂与规格】丁溴东莨菪碱片：10 mg。

丁溴东莨菪碱胶囊：10 mg。

丁溴东莨菪碱注射液：① 1 ml ∶ 10 mg；② 1 ml ∶ 20 mg；③ 2 ml ∶ 20 mg。

丁溴东莨菪碱口服溶液：5 ml ∶ 5 mg。

3.1.4.2 促胃肠动力药

由于胃溃疡多有胃排空延缓、十二指肠胃反流，因而增加胃动力、协调胃十二指肠蠕动对治疗胃溃疡有一定意义。

多潘立酮[基(基)，保(甲)]

Domperidone

【适应证】(1) 因胃排空延缓、胃食管反流性食管炎引起的消化不良。(2) 功能性、器质性、感染性、饮食性、放射性治疗及化疗引起的恶心和呕吐。

【注意事项】(1) 肝功能损害者慎用。

(2) 严重肾功能不全者应调整剂量。(3)妊娠慎用。(4)血清催乳素水平可升高。(5) 心脏病患者（心律失常）、低钾血症以及接受化疗的肿瘤患者使用本品时，有可能加重心律失常。

【禁忌证】对本品过敏者、嗜铬细胞瘤、乳腺癌、分泌催乳素的垂体肿瘤（催乳素瘤）、机械性肠梗阻、胃肠道出血、穿孔者禁用。禁与酮康唑（口服制剂）、氟康唑、伏立康唑、红霉素、克拉霉素、胺碘酮合用。

【不良反应】头痛、头晕、嗜睡、倦怠、神经过敏；罕见张力障碍性反应、癫痫发作；非哺乳期泌乳、更年期后妇女及男性乳房胀痛、月经失调；偶见口干、便秘、腹泻、痉挛性腹痛、心律失常、一过性皮疹或瘙痒。

【用法与用量】口服：成人，一次 10 mg 或 10 ml，一日 3 ~ 4 次；儿童，按体重一次 0.3 mg/kg；均为餐前 15 ~ 30 分钟服用。

【制剂与规格】多潘立酮片：10 mg。

多潘立酮混悬液：1 ml : 1 mg。

甲氧氯普胺 [基(基)，保(甲)]

Metoclopramide

【适应证】镇吐药。主要用于：①各种病因所致恶心、呕吐、嗳气、消化不良、胃部胀满、胃酸过多等症状的对症治疗；②反流性食管炎、胆汁反流性胃炎、功能性胃滞留、胃下垂等；③残胃排空延迟症、迷走神经切除后胃排空延缓；④糖尿病性胃轻瘫、尿毒症、硬皮病等胶原疾病所致胃排空障碍。

【注意事项】(1) 肝肾衰竭者慎用。(2) 妊娠期妇女不宜使用。(3) 哺乳期妇女在用药期间应停止哺乳。(4) 小儿不宜长期应用。(5) 老年人大量长期应用容易出现锥体外系症状。(6) 本品可使醛固酮与血清泌乳素浓度升高。(7) 对胃溃疡胃窦潴留者或十二指肠球部溃疡合并胃窦部炎症者有益，不宜用于一般十二指肠溃疡。(8) 对晕动病所致呕吐无效。(9) 因本品可降低西咪替丁的口服生物利用度，若两药必须合用，间隔时间至少要 1 小时。(10) 静脉注射时需慢，1 ~ 2 分钟注完，快速给药可出现躁动不安，随即进入昏睡状态。

【禁忌证】对普鲁卡因或普鲁卡因胺过敏者、癫痫患者、胃肠道出血、机械性梗阻或穿孔、嗜铬细胞瘤、放疗或化疗的乳癌患者、抗精神病药致迟发性运动功能障碍史者。不可用于因行化疗和放疗而呕吐的乳癌患者。

【不良反应】常见昏睡、烦躁不安、倦怠无力；少见乳腺肿痛、恶心、便秘、皮疹、腹泻、睡眠障碍、眩晕、严重口渴、头痛、易激动、乳汁增多、直立性低血压、躁动不安、昏睡状态、锥体外系反应。

【用法与用量】(1) 口服：①一般性治疗，一次 5 ~ 10 mg，一日 10 ~ 30 mg，餐前 30 分钟服用；②糖尿病性胃排空功能障碍，于症状出现前 30 分钟口服 10 mg，或于三餐前及睡前口服 5 ~ 10 mg，一日 4 次。(2) 肌内注射：一次 10 ~ 20 mg，一日剂量不宜超过 0.5 mg/kg，否则易引起锥体外系反应。(3) 静脉滴注：一次 10 ~ 20 mg，用于不能口服者或治疗急性呕吐。严重肾功能不全患者剂量至少需减少 60%。

【制剂与规格】甲氧氯普胺片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

甲氧氯普胺注射液：① 1 ml : 10 mg；② 1 ml : 20 mg。

莫沙必利 [保(乙)]

Mosapride

【适应证】用于功能性消化不良、胃食管反流病、糖尿病胃轻瘫、胃大部切除术患者的胃功能障碍。

【注意事项】(1) 妊娠和哺乳期妇女应避免使用本品。(2) 老年人注意观察。(3) 服用 2 周消化道症状无变化时，应即停药。

【禁忌证】对本品过敏者、胃肠道出血、阻塞或穿孔以及其他刺激胃肠道可能引起危险的疾病。

【不良反应】腹泻、腹痛、口干、皮疹、倦怠、头晕；偶见嗜酸性粒细胞增多、三酰甘油升高、ALT 及 AST 升高、碱性磷酸酶及 γ - 谷氨酰转肽酶升高。

【用法与用量】口服：一次 5 mg，一日 3 次，餐前服用。

【制剂与规格】枸橼酸莫沙必利片：5 mg。

枸橼酸莫沙必利分散片：5 mg。

伊托必利（依托必利）[保(乙)]

Itopride

【适应证】本品适用于因胃肠动力减慢（如功能性消化不良、慢性胃炎等所致）引起的消化不良症状，包括上腹部饱胀感、上腹痛、食欲缺乏、恶心和呕吐等。

【注意事项】(1) 严重肝肾功能不全者慎用。(2)妊娠期、哺乳期妇女及儿童慎用。(3) 本品能增强乙酰胆碱的作用，必须谨慎使用。(4) 本品使用中若出现心电图QTc间期延长，应停药。(5) 虽然未证实本品对驾驶和操作的能力有影响，但由于偶尔可发生眩晕和激动，故应注意药物对人体机敏性的影响。

【禁忌证】见莫沙必利。

【不良反应】偶见皮疹、发热、瘙痒、腹泻、腹痛、便秘、唾液增加、头痛、睡眠障碍、白细胞减少、BUN及肌酐升高、胸背部疼痛、疲劳、手指发麻、手抖、肝功能异常和黄疸等。

【用法与用量】口服：一次 50 mg，一日 3 次，餐前服用，根据年龄、症状适当增减或遵医嘱，可将药片分切后口服。若用药 2 周后症状改善不明显，宜停药。

【制剂与规格】伊托必利片：50 mg。

3.2 幽门螺杆菌感染及其用药

3.2.1 根除方案

初始治疗方案可以采用疗程为 1 周的三联疗法，包含 PPI、克拉霉素、阿莫西林或甲硝唑。如果患者因为其他原因的感染使用过甲硝唑，初始方案中最好不再用甲硝唑。通常情况下疗程结束后无需使用质子泵抑制药或 H_2 受体拮抗药继续抑酸治疗，除非溃疡较大，或伴发出血、穿孔。治疗失败常常是因为抗生素耐药或依从性差。阿莫西林耐药很罕见。

为期 2 周的三联疗法与 1 周的三联疗法相比可能有更高的根除率，但是不良反应更常见，而且较差的依从性将会抵消所有的优势。我国当前推荐 10 日疗程。

推荐的 Hp 根除方案如下。

3.2.1.1 一线方案

(1) 三联疗法：PPI（常规剂量）+ Amo(1.0 g)或 Met(0.5 g)+Cla(0.5 g)，一日 2 次，疗程 7 ~ 14 日，根除率为 70% ~ 84%；(Amo 过敏者可以换用 Lev 一日 0.5 g)。

(2) 四联疗法：根除率为 80% ~ 90%。① PPI(常规剂量)+Bis(常规剂量)+Met (0.5g 3 次 / 日) +Tet (0.75 ~ 1.0 g)，一日 2 次，疗程 10~14 日；② PPI（常规剂量）+Bis（常规剂量）+ Fur (0.1 g) +Tet (0.75 ~ 1.0 g)，一日 2 次，疗程 10 ~ 14 日。(其中 Amo= 阿莫西林；Bis= 铋剂；Cla= 克拉霉素；Fur= 呋喃唑酮；Lev= 左氧氟沙星；Met= 甲硝唑；PPI= 质子泵抑制药；Tet= 四环素)。

3.2.1.2 补救方案

具体方案要根据药敏试验决定；可考虑增加的药物有氟喹诺酮类（左氧氟沙星）、利福霉素、利福布汀、头孢菌素类抗生素。在我国，甲硝唑的耐药率为 50% ~ 100%，克拉霉素的耐药率为 10% ~ 40%，阿莫西林的耐药率为 0% ~ 2.7%。

3.2.2 疗效判断

建议首选 ^{13}C 尿素呼气试验，其次为粪便 Hp 抗原检查。复查时间应在 Hp 根除治疗停止后至少 4 周进行。如果行内镜下快速尿素酶试验，活检部位应包括胃窦和胃体。

3.3 胃炎及其用药

3.3.1 急性胃炎的药物治疗

急性胃炎（acute gastritis）多种病因引起的胃黏膜急性炎症，病程短，短期内可治愈。以细菌及其毒素引起最常见。通常以不洁饮食引起，表现急性腹痛、恶心、呕吐等，常合并急性肠炎。若只表现恶心、呕吐、上腹痛则为急性胃炎，若伴腹泻则为急性胃肠炎。治疗原则：①去除病因，如有细菌感染者可加用抗感染药，一般按常用顺序选择盐酸小檗碱、环丙沙

星、诺氟沙星；②清淡流食，必要时禁食1～2餐；③注意电解质紊乱及脱水；④对症处理，如使用解痉药（见3.1.4.1，阿托品、颠茄、氢溴酸山莨菪碱）。

3.3.2 慢性胃炎的药物治疗

慢性胃炎（chromic gastritis）为不同致病损伤因子长期作用于胃黏膜引起的慢性炎性改变或萎缩性的改变，其中Hp感染是一个很重要的因素。慢性胃炎的病因、临床症状多种多样，用药治疗亦要个体化治疗，尤其要注意精神、心理因素。

原则：①抗酸药物（见3.1.1）。包括各类弱碱性物质及各种复方制品，如复方氢氧化铝、铝碳酸镁，特点是作用快而强。当前认为铝碳酸镁除有中和酸的作用外，尚有强化黏膜防御功能和抑制损伤因子的作用。②解痉药（见3.1.4.1）。当胃炎导致胃痉挛性疼痛时可适当选用抗胆碱药物。如颠茄、阿托品、山莨菪碱、曲美布汀、匹维溴胺（见3.6）。③胃黏膜保护药（见3.1.3）。主要作用是促进黏液分泌、细胞再生，稳定细胞膜，增加内源性前列腺素E。④根除Hp治疗（见3.2.1）。Hp感染是慢性胃炎的重要致病原因之一，根除Hp治疗有利于慢性胃炎的恢复。虽然Hp是慢性胃炎的重要致病因素，但根除治疗后其症状缓解率只有30%左右。⑤促动力药。动力失调与慢性胃炎互为因果，促进胃排空有利于改善胃炎症状和防止复发。⑥抑酸治疗。慢性胃炎患者胃酸可增高或降低，有明显反酸症状者，适当抑制胃酸分泌有利于减轻胃黏膜的损伤和炎症的修复，一般用H_2受体拮抗药。⑦助消化药物。当腺体萎缩，黏膜屏障作用减退，胃酸、消化酶分泌减弱，致胃化学性消化功能减退，如胀满，使用消化酶类药物，可协助改善消化不良症状。胃消化酶分泌降低可适当配合消化酶制剂。

胰酶[保(乙)]

Pancreatin

【适应证】用于各种原因引起的胰腺外分泌功能不足（如囊性纤维化、慢性胰腺炎、胰腺切除术后、胃切除术后、肿瘤引起的胰管或胆总管阻塞、慢性胰腺炎性疼痛、老年人、胃肠、肝胆疾病）的替代治疗。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 用药过量可引起恶心、胃痉挛、皮疹、血尿、关节痛、脚或小腿肿胀以及腹泻。用药过量时给予一般支持治疗即可。

【禁忌证】(1) 急性胰腺炎早期患者。(2) 对猪蛋白及其制品过敏者。

【不良反应】偶见过敏反应，可见打喷嚏、流泪、皮疹、鼻炎和支气管哮喘等。囊性纤维化的患者应用本品治疗，可出现尿中尿酸增多，且与剂量相关。

【用法与用量】口服：成人一次0.3～1 g，一日3次，餐前或进餐服；5岁以上的儿童一次0.3 g，一日3次，餐前或进餐时服。

【制剂与规格】胰酶肠溶片：① 0.3 g；② 0.5 g。

胰酶胶囊：① 0.15 g；② 0.22 g

米曲菌胰酶片（Oryz-Aspergillus Enzyme and Pancreatin）：每片含米曲菌霉提取物24 mg、胰酶220 mg。用于由消化酶绝对不足或相对不足而引起的各类消化不良症。口服，成人和12岁以上的儿童一次1片，一日3次，餐中或餐后吞服。

复方阿嗪米特肠溶片[保(乙)] 每片含阿嗪米特75 mg、胰酶100 mg（胰淀粉酶5 850 U、胰蛋白酶185 U、胰脂肪酶3 320 U）、纤维素酶10 mg、二甲硅油50mg。用于因胆汁分泌不足或消化酶缺乏消化不良而引起的症状，也可用于慢性胆囊炎或胆囊炎切除后引起的消化不良症状。口服：一次1～2片，一日3次，餐后服用。以下情况禁用，如肝功能障碍、因胆石症引起的胆绞痛、胆管阻塞、急性肝炎等。

复方消化酶胶囊 每粒胶囊含胃蛋白酶25 mg、木瓜酶50 mg、淀粉酶15 mg、熊去氧胆酸25 mg、纤维素酶15 mg、胰酶50 mg、胰酶13 mg。用于食欲缺乏、消化不良，包括腹部不适、嗳气、早饱、餐后腹胀、恶心、排气过多、脂肪便，也可用于胆囊炎和胆结石以及胆囊切除者消

化不良。口服：一次 1 ~ 2 粒，一日 3 次，餐后服（服用时可将胶囊打开，但不可嚼碎药粒）。过敏体质者慎用。不良反应可见呕吐、腹泻、软便、口内不快感。对急性肝炎患者及胆道完全闭锁患者禁用，对本品过敏者禁用。

胃蛋白酶

Pepsin

【适应证】用于消化不良、食欲减退及慢性萎缩性胃炎等。

【注意事项】遇热不稳定，70℃以上失效。溶液在 pH 6.0 以上不稳定。本品易吸潮，使蛋白消化力降低，如已吸潮或变性者不宜服用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】无明显不良反应。

【用法与用量】口服：①胃蛋白酶片，一次 0.2 ~ 0.4 g，一日 3 次，餐前服用，同时服稀盐酸一次 0.5 ~ 2 ml。②含糖胃蛋白酶片，一次 2 ~ 4 g，一日 3 次，餐前服用，同时服稀盐酸一次 0.5 ~ 2 ml。③胃蛋白酶合剂，一次 10 ~ 20 ml，一日 3 次。餐前或进食时服用。5 岁以上儿童一次 1 片，一日 3 次，餐前服用。

【制剂与规格】胃蛋白酶片：0.1 g。

含糖胃蛋白酶片：每 1 g 不低于 120 活力单位（或 1 200 U）。

胃蛋白酶合剂：100 ml 含胃蛋白酶 3 g、稀盐酸 3 ml、橙皮酊 3 ml、糖浆 10 ml（或甘油 6 ml）。

多酶片　每片含淀粉酶 0.12 g、胃蛋白酶 0.04 g、胰酶 0.12 g。用于消化不良和增进食欲。口服：成人一次 1 ~ 2 片，一日 3 次，儿童酌减。对本品各成分过敏者禁用。无明显不良反应。

乳糖酶

Lactase

【适应证】主要用于“乳糖不耐受症”患者，此类患者不能消化乳糖，伴有腹泻、消化不良、灼热以及肠易激综合征等症状。

【注意事项】使用后症状无明显改善者应停止使用并咨询医师。妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】对乳糖酶过敏者禁用。

【用法与用量】口服：在进食含乳糖的食物前服用。成人或 12 岁以上儿童，一次 1 ~ 3 片嚼服或吞服。12 岁以下儿童，一般不应服用，或在医师指导下使用。

【制剂与规格】乳糖酶片：每片含乳糖消化酶 3 000 FCC U。

干酵母 [保（乙）]

Dried Yeast

【适应证】用于消化不良、食欲减退、腹泻及胃肠充气。

【注意事项】过敏体质者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】服用剂量过大可发生腹泻。

【用法与用量】口服：成人一次 0.5 ~ 4 g；儿童一次 0.3 ~ 0.9 g。均一日 3 次嚼碎后服。

【制剂与规格】干酵母片：① 0.3 g；② 0.5 g。

干酵母复方制剂：食母生每片含干酵母 0.2 g、碳酸钙 0.04 g、蔗糖 0.11 g。

维他益片：每片含啤酒酵母 0.2 g、碳酸钙 0.025 g、蔗糖 0.07 g。

乳酶生 [基（基），保（甲）]

Lactasin

【适应证】用于消化不良、肠内过度发酵、肠炎、腹泻等。

【注意事项】本品应在冷暗处保存。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】未见明显不良反应。

【用法与用量】口服：成人一次 0.3 ~ 1 g，一日 3 次，餐前服用。1 岁以下儿童一次 0.1 g；5 岁以下儿童一次 0.2 ~ 0.3 g；5 岁以上儿童一次 0.3 ~ 0.6 g，均一日 3 次，餐前服用。

【制剂与规格】乳酶生片：① 0.1 g；② 0.15 g；③ 0.3 g。

3.4 胃食管反流病及其药物治疗

胃食管反流病（GERD）是指胃内容物反流入食管引起不适症状和（或）并发症的一种疾病。GERD 可分为三种类

型：非糜烂性反流病、糜烂性食管炎和Barrett食管。

GERD的治疗目标是缓解症状，治愈食管炎，提高生活质量，预防复发和并发症。除改变生活方式是GERD的基础治疗之外，GERD的药物治疗包括如下几种情况：

（1）抑制胃酸分泌是目前治疗GERD的主要措施，抑制胃酸的药物包括H_2RA和PPI等。

①初始治疗的目的是尽快缓解症状，治愈食管炎。H_2RA（见3.1.2.1）仅适用于轻至中度GERD治疗。西咪替丁，一次400 mg，一日4次；雷尼替丁，一次150～300 mg，一日2次；法莫替丁，一次20～40 mg，一日2次。PPI（见3.1.2.2）抑酸能力强，是GERD治疗中最常用的药物，疗效明显优于H_2受体拮抗药。奥美拉唑，一次20 mg，一日1～2次；兰索拉唑，一次30 mg，一日1～2次；泮托拉唑，一次40 mg，一日1～2次；埃索美拉唑，一次20 mg，一日1～2次；雷贝拉唑，一次10 mg，一日1～2次。伴有食管炎的GERD治疗首选PPI。非糜烂性GERD治疗的主要药物是PPI。凡具有胃灼热、反流等典型症状者，如无警戒症状即可予以PPI进行经验性治疗。初始治疗有两种治疗方案，一是降阶治疗，初始治疗时即采用最有效的药物PPI，迅速缓解症状；二是升阶治疗，从H_2RA开始用起，若症状不能缓解则继续采用抑酸能力更强的药物。目前的研究提示前者更符合经济-成本效益。

②维持治疗是巩固疗效、预防复发的重要措施，用最小的剂量达到长期治愈的目的，治疗应个体化。目前维持治疗的方法有3种，即维持原剂量或减量、间歇用药、按需治疗。维持原剂量或减量使用PPI，一日1次，长期使用以维持症状持久缓解，预防食管炎复发。间歇治疗：PPI剂量不变，但延长用药周期，最常用的是隔日疗法，在维持治疗过程中，若症状出现反复，应增至足量PPI维持。按需治疗，仅在出现症状时用药，症状缓解后即停药。按需治疗建议在医师指导下，由患者自己控制用药，没有固定的治疗时间，治疗费用低于维持治疗。抗酸剂铝碳酸镁（见3.1.1）可作为GERD维持治疗的一个选择。部分患者症状程度轻，发作频率低，使用铝碳酸镁维持可降低成本。铝碳酸镁一日3次，一次500～1 000 mg；或者出现症状时服用500～1 000 mg。

③Barrett食管（BE）治疗应用PPI尚无定论。BE伴有糜烂性食管炎及反流症状者，建议采用大剂量PPI治疗，并提倡长期维持治疗。

④控制夜间酸突破（NAB）是GERD治疗的措施之一。治疗方法包括调整PPI剂量、睡前加用H_2RA或应用血浆半衰期更长的PPI等。

⑤对PPI治疗失败的患者，应寻找原因，积极处理。有部分患者经标准剂量PPI治疗后，症状不能缓解。可能的原因有患者依从性差，服药不正规；与个体差异有关；存在NAB；内脏高敏感；存在非酸反流。

（2）可选择性使用促动力药。在GERD的治疗中，抑酸药物治疗效果不佳时，考虑联合应用促动力药，特别是对于伴有胃排空延迟的患者。常用的包括多潘立酮和莫沙必利（见3.1.4.2）。多潘立酮，一次10 mg，一日3次；莫沙必利，一次5 mg，一日3次。

3.5　炎症性肠病及其药物治疗

炎症性肠病（inflammatory bowel disease，IBD）是一种病因尚不明确的慢性非特异性肠道炎症性疾病，包括溃疡性结肠炎（ulcerative colitis，UC）和克罗恩病（Crohn's disease，CD）。前者是一种慢性非特异性结肠炎症，病变主要累及结肠黏膜和黏膜下层，范围多自远段结肠开始，可逆行向近段发展，甚至累及全结肠及末段回肠，呈连续性分布，临床主要表现为腹泻、腹痛和黏液脓血便。后者为一种慢性肉芽肿性炎症，病变可累及胃肠道各部位，以末段回肠及其邻近结肠为主，呈穿壁性炎症，多呈节段性、非对称性分布，临床主要表现为腹痛、腹泻、瘘管、肛门病变等。IBD的治疗包括药物治疗、营养支持，对于重症和慢性活动型药物治

疗无效或因药品不良反应无法用药者，必要时则需要外科手术治疗。

IBD 药物治疗的原则是依据不同分级（疾病的严重程度）、分期（活动期和缓解期）及病变范围不同、分段进行治疗。治疗目标是尽快控制炎症、缓解症状和继续维持治疗。氨基水杨酸类药物和糖皮质激素仍是目前药物治疗的基础，免疫抑制药和细胞因子调节药的应用日益增多。

（1）活动期 UC 和 CD 的治疗：累及直肠（直肠炎型）或直肠、乙状结肠（远端结肠炎型）的急性轻、中度 UC 的初始治疗方案是选择口服或局部作用的氨基水杨酸，或局部作用的糖皮质激素，不能耐受液体灌肠剂可选用栓剂。重度远端 UC 需要局部应用糖皮质激素同时联合全身糖皮质激素治疗。

广泛型 UC 轻度患者只需口服氨基水杨酸类药物，中度广泛型 UC 如口服氨基水杨酸类药物效果不佳，予中等剂量糖皮质激素口服，如泼尼松一日 40 ~ 60 mg。重度患者予足量静脉应用糖皮质激素，如氢化可的松一日 300 mg，观察 7 ~ 10 日后无效者，《临床诊疗指南》（2007）建议在少数医学中心可考虑环孢素静脉滴注，一日按体重 2 ~ 4 mg/kg，也可考虑其他免疫抑制药。

轻度 CD 患者可单独使用氨基水杨酸，中度或难治性 CD 患者需要口服糖皮质激素药物治疗。

英夫利西单抗已用于治疗对糖皮质激素和传统免疫抑制药联合治疗效果不充分或不耐受治疗的重度活动期 CD 患者，还可用于治疗有瘘管形成的难治性 CD 患者。但其价格十分昂贵。

甲硝唑可用于累及肛周活动期 CD 患者，可能与其抗菌作用有关。一日 0.6 ~ 1.5 g，分次口服，疗程 1 个月，不能超过 3 个月，否则易致外周神经病变。

（2）缓解期 UC 和 CD 的维持治疗：除初发病例、轻症远段结肠炎患者症状完全缓解后，可停药观察外，所有患者完全缓解后均应继续维持治疗。维持治疗的时间尚无定论，可能 3 ~ 5 年甚至终身用药，诱导缓解后 6 个月内复发者也应维持治疗。一般认为糖皮质激素无维持治疗效果，在症状缓解后逐渐减量，应尽可能过渡到用氨基水杨酸维持治疗。巯嘌呤或硫唑嘌呤等用于对上述药不能维持或对糖皮质激素依赖者。

3.5.1 氨基水杨酸类药

柳氮磺胺吡啶是 5-氨基水杨酸（5-ASA）与磺胺吡啶的复合物，磺胺吡啶仅仅是作为载体将 5-ASA 运送到结肠发挥作用。5-ASA 制剂，如美沙拉秦（5-ASA）、巴柳氮钠（5-ASA 前体药）、奥沙拉嗪（5-ASA 二聚体，在肠道下段分解），可以避免柳氮磺胺吡啶中磺胺吡啶相关的不良反应，但 5-ASA 也可引起一定的不良反应，如血液系统改变、全身性红斑狼疮综合征等。

美沙拉秦（美沙拉嗪）[保(乙)]

Mesalazine

【适应证】用于溃疡性结肠炎，包括急性发作和复发、克罗恩病急性发作。

【注意事项】（1）妊娠及哺乳期妇女用药。只有在严格的指征下，妊娠前 3 个月才能使用本品。需要生育的妇女，在开始妊娠前，除非没有其他药物可用，应尽可能少的使用本品；如个体情况允许，妊娠的最后 2 ~ 4 周应停用本品。哺乳期妇女如确需服用，在用药期间应停止哺乳。（2）建议幼儿和儿童不使用本品。（3）高龄患者用本品应酌减。（4）在治疗期间，在医生的指导下，应注意血细胞计数和尿检查。一般情况下，在治疗开始 14 日，就应该进行这些检查。此后，每用药 4 周，应进行相应检查，这种检查应进行 2 ~ 3 次。如果未见异常，每 3 个月应进行 1 次血清尿素氮（BUN）、血肌酐和尿沉渣等反应肾功能的检查。（5）治疗期间，注意监测高铁血红蛋白值水平。（6）肺功能障碍的患者，特别是哮喘患者，在治疗期间，应密切进行监测。（7）对包含硫酸酯酶的制剂过敏的患者，只有在医学监测下，才能使用本品。治疗中，如果出现不可耐受的反应，如急性腹痛、痉挛、发热、严重头痛以及皮肤红斑等，应立即停用本品。（8）本品过量时，应尽快咨询医师，立即洗胃，并加速排尿。本品无特异拮抗药。

【禁忌证】水杨酸过敏者、严重肝肾功能不全者、胃及十二指肠溃疡者、出血体质者（易引起出血）。

【不良反应】偶见腹部不适、腹泻、胃肠胀气、恶心、呕吐、头痛、头晕；极少见过敏性红肿、药物热、支气管痉挛、外周性心包心肌炎、急性胰腺炎和间质性肾炎等；偶有肺泡炎；个别病例出现全肠炎；一些与美沙拉秦有类似结构的药物可引起红斑狼疮样综合征，所以不排除美沙拉秦也有引起这种反应的可能性；偶见肌肉痛和关节痛；可能有高铁血红蛋白水平升高；个别病例出现贫血、粒细胞缺乏症、全血细胞减少、中性白细胞减少症、白细胞减少和血小板减少等；罕见转氨酶升高。

【用法与用量】(1) 口服：①常规剂量一日 1.5 g，分 3 次服用。②溃疡性结肠炎急性发作期，一日 1.5 ~ 4 g，缓解期／长期治疗期一日 1.5 g。③克罗恩病急性发作期，一日 1.5 ~ 4.5 g。分 3 次服用，应在早、中、晚餐前 1 小时，肠溶片整片用足量水送服。(2) 直肠给药：①栓剂一次 250 ~ 500 mg，一日 2 ~ 3 次置肛，或一次 1 g，一日 1 ~ 2 次置肛。②灌肠剂一次 4 g，一日 1 次，睡前用药，从肛门灌进大肠。

【制剂与规格】美沙拉秦肠溶片：① 250 mg；② 500 mg。

美沙拉秦缓释颗粒：500 mg。

美沙拉秦栓：1 g。

美沙拉秦灌肠剂：60 ml：4 g。

巴柳氮钠

Balsalazide Sodium

【适应证】用于轻、中度活动性溃疡性结肠炎及缓解期维持治疗。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用，5-氨基水杨酸可透过胎盘屏障，但数据有限，不足以评价可能出现的不良反应。动物实验未发现致畸。乳汁中分泌有 5-氨基水杨酸，其浓度远小于在母体血液中的浓度；没有报道母体因服用 5-氨基水杨酸不良反应，但数据有限。(2) 儿童慎用。(3) 尚无老年患者应用本品的资料。(4) 患有幽门狭窄的患者可能会延长巴柳氮钠的胃中停留时间。(5) 对已知肾功能障碍或有肾病史的患者应注意使用。应定期监测患者的肾功能（如血清肌酐），特别是在治疗初期。如患者在治疗期间出现肾功能障碍，可能出现出血、青肿、咽喉痛和发热、心肌炎以及气短伴随的发热和胸痛。若出现上述不良反应应与医师联系，并停止治疗。有哮喘病史者慎用。

【禁忌证】对水杨酸、巴柳氮钠中任何成分或巴柳氮钠代谢物过敏的患者禁用。

【不良反应】常见腹痛、腹泻；偶见食欲减退、便秘、消化不良、腹胀、口干、黄疸、咳嗽、咽炎、鼻炎等、关节病、肌痛、疲乏、失眠、泌尿系统感染。

【用法与用量】口服：用于活动期一次 1.5 g，一日 3 ~ 4 次；缓解期一次 1.5 g，一日 2 次。

【制剂与规格】巴柳氮钠片：① 500 mg；② 750 mg。

巴柳氮钠胶囊：① 0.375 g；② 0.75 g。

巴柳氮钠颗粒：① 0.375 g；② 0.75 g。

奥沙拉秦

Olsalazine

【适应证】用于治疗急、慢性溃疡性结肠炎与节段性回肠炎，并用于缓解期的长期维持治疗。

【注意事项】(1) 尚无老年患者应用本品的资料。(2) 有胃肠道反应者慎用。(3) 一旦发现漏服可立即补服，但不要在同一时间用 2 倍剂量。

【禁忌证】对水杨酸过敏者、严重肝肾功能损害者、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】腹泻最常见，通常短暂，在治疗开始或增加剂量时发生，减少剂量后可缓解；其他不良反应为腹部痉挛、头痛、失眠、恶心、消化不良、皮疹、头晕和关节痛等。

【用法与用量】口服：治疗开始时，成人，一日剂量 1 g，分 3 次服用，必要时一日剂量可增加至 3 g，分 3 ~ 4 次服用；儿童，一日剂量 20 ~ 40 mg/kg。维持治疗，成人，一日剂量 1 g，分 2 次服用；儿童，一日剂量 15 ~ 30 mg/kg。本品随食物同服。

【制剂与规格】奥沙拉秦胶囊：① 250 mg，② 500 mg。

奥沙拉秦片：① 250 mg；② 500 mg。

柳氮磺吡啶[保(甲)]

Sulfasalazine

【适应证】用于轻、中、重度溃疡性结肠炎及缓解期维持治疗，活动期克罗恩病，特别是累及结肠的患者。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用，对肾功能损害者应减小剂量。(2) 老年患者应用磺胺药发生严重不良反应的概率增加，如严重皮疹、骨髓抑制和血小板减少等，是老年人严重不良反应中常见者。因此老年人宜避免应用，确有指征时需权衡利弊后决定。(3) 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏、肝功能不全、肾功能不全、血卟啉症、血小板、粒细胞减少、血紫质症、肠道或尿路阻塞患者慎用。(4) 服用期间应多饮水，保持高尿流量，以防结晶尿的发生，必要时服碱化尿液的药物；失水、休克和老年患者应用本品易致肾损害，应慎用或避免应用本品。(5) 对呋塞米、砜类、噻嗪类利尿药、磺脲类、碳酸酐酶抑制药及其他磺胺药过敏者慎用。(6) 治疗中须注意检查，如全血象检查、直肠镜与乙状结肠镜检查，观察疗效调整剂量；尿液检查（每 2 ~ 3 日查尿常规一次），以发现长疗程或高剂量治疗时可能发生的结晶尿；肝、肾功能检查。(7) 遇有胃肠道刺激症状，除强调餐后服药外，也可分成小量多次服用，甚至一小时 1 次，使症状减轻。(8) 根据患者的反应与耐药性，随时调整剂量，部分患者可采用间歇治疗（用药 2 周，停药 1 周）。(9) 腹泻症状无改善时，可加大剂量。(10) 夜间停药间隔不得超过 8 小时。

【禁忌证】对磺胺及水杨酸盐过敏者、肠梗阻或泌尿系梗阻患者、急性间歇性卟啉症患者禁用；妊娠及哺乳期妇女及 2 岁以下儿童禁用。

【不良反应】常见恶心、厌食、体温升高、红斑、瘙痒、头痛、心悸。少见且与剂量有关的不良反应有红细胞异常（如溶血性贫血、巨幼细胞贫血）、发绀、胃痛及腹痛、头晕、耳鸣、蛋白尿、血尿、皮肤黄染。可能与剂量无关的不良反应有骨髓抑制如伴有白细胞减少、粒细胞减少、血小板减少、肝炎、胰腺炎、周围神经病变、无菌性脑膜炎、出疹、荨麻疹、多形性红斑、剥脱性皮炎、表皮坏死溶解综合征、光敏感性、肺部并发症（纤维性肺泡炎伴有如：呼吸困难、咳嗽、发热、嗜酸粒细胞增多症）、眶周水肿、血清病、LE 综合征、肾病综合征；曾报道使用柳氮磺吡啶治疗的男性出现精液缺乏性不育，停止用药可逆转此反应。

【用法与用量】(1) 口服：用于炎症性肠病（主要为溃疡性结肠炎）。①成人，一日 4 ~ 6 g，分次口服，用药间隔应不超过 8 小时为宜，为防止消化道不耐受，初始以一日 1 ~ 2 g 的小剂量开始，如果每日超过 4 g，应警惕毒性增加。严重发作时，一次 1 ~ 2 g，一日 3 ~ 4 次，可与糖皮质激素合用，组成强化治疗方案。轻度及中度发作时，一次 1 g，一日 3 ~ 4 次。缓解期，建议给予维持剂量以防症状重现，一般一日 2 ~ 3 次，一次 1 g。②儿童，按体重一日 40 ~ 60 mg/kg 的剂量，分 3 ~ 6 次服用。防止复发，按体重一日 20 ~ 30 mg/kg 的剂量，分 3 ~ 6 次服用。(2) 栓剂：重症患者每日早、中、晚排便后各用肛栓 1 粒，中或轻症患者早晚排便后各用肛栓 1 粒，症状明显改善后，改用维持量，每晚或隔日晚用肛栓 1 粒，晚间给药时间最好在睡前。

【制剂与规格】柳氮磺吡啶肠溶片：250 mg。

柳氮磺吡啶栓：500 mg。

3.5.2 糖皮质激素

醋酸泼尼松或泼尼松龙[保(甲/乙)] 适用于活动期中、重度溃疡性结肠炎和克罗恩病。口服：一日 20 ~ 60 mg，单次或分 2 次服用，直到病情明显缓解。溃疡性结肠炎的疗程较短，克罗恩病的疗程较长，用药 8 ~ 12 周。以后逐渐减量，每周减量 5 mg。(其他见 5.4.4.2)

布地奈德[保(乙)] 适用于病变以回肠、升结肠为主的克罗恩病。口服：一日 9 mg，上午服用，疗程 8 周，停药前 2 ~ 4 周开始减量。(其他见 2.4)

第3章 消化系统疾病用药

氢化可的松[基(基),保(甲)] 适用于溃疡性结肠炎、直肠炎、直肠乙状结肠炎。静脉滴注：重度患者，一日 300 ~ 400 mg。直肠给药：一日 100 ~ 200 mg，睡前保留灌肠，疗程 1 ~ 3 个月。局部用药时可部分吸收，因此避免长期应用。灌肠应选用水溶性剂型。肠梗阻、肠穿孔和广泛肠瘘时禁用灌肠和直肠泡沫灌肠剂；禁用于合并感染。(其他见 5.4.4.2)

甲泼尼龙[保(乙)] 适用于重度活动期溃疡性结肠炎和克罗恩病患者。静脉滴注：一日 40 ~ 60 mg。(其他见 5.4.4.2)

3.5.3 免疫抑制药

环孢素[保(甲)] 适用于重度或顽固性病例，特别是溃疡性结肠炎。静脉滴注：按体重一日 2 ~ 4 mg/kg。(其他见 8.8)

硫唑嘌呤[保(甲)]、**巯嘌呤**[保(乙)]**或甲氨蝶呤**[保(甲)] 适用于 UC 和 UD 重度或顽固性病例。口服：硫唑嘌呤按体重一日 1.5～3 mg/kg；巯嘌呤按体重一日 0.75～1.5 mg/kg；肌内注射：甲氨蝶呤一次 15～25 mg，一周 1 次。(其他见 7.1.2.3)

3.5.4 细胞因子调节药

英夫利西单抗是抗 - 肿瘤坏死因子 - α(TNF-α)的单克隆抗体，该药必须在复苏设备齐全的医疗机构，由专科医师应用。

英夫利西单抗

Infliximab

【适应证】用于重度／顽固性克罗恩病、瘘管性克罗恩病。

【注意事项】已存在严重感染如结核、真菌或细菌感染者需慎用。慢性心力衰竭患者、有异型性增生、结肠癌病史者慎用。

【禁忌证】已知对鼠源蛋白或本品其他成分过敏者禁用。对于患有中重度心力衰竭的患者，给予本品 10 mg/kg 可能因心力衰竭加重而增加住院率和死亡率。因此，剂量高于 5 mg/kg 时禁用于中重度心力衰竭患者。

【不良反应】皮肤（皮疹、瘙痒、荨麻疹、真菌性皮炎、甲真菌病)、中枢神经系统（头痛、眩晕)、呼吸系统（上、下呼吸道感染，呼吸困难，鼻窦炎，胸膜炎，肺水肿)、胃肠道反应（恶心、腹泻、腹痛、呕吐)、肝功能异常；心血管（高血压、低血压)、过敏反应、条件性感染。

【用法与用量】静脉滴注：成人和 18 岁以上青少年初始剂量为 5 mg/kg，在首次给药后的第 2 周、第 6 周再给 5 mg/kg，然后每 8 周给药 5 mg/kg；对于疗效不佳的患者，可考虑将剂量调整至 10 mg/kg。维持治疗剂量的间隔根据疗效确定，如果 10 周内还没效果则停药。

【制剂与规格】注射用英夫利昔单抗：100 mg。

(其他见 7.1.2.4)

3.6 肠易激综合征及其药物治疗

肠易激综合征(irritable bowel syndrome，IBS）是临床上最常见的一种胃肠道功能紊乱性疾病，是一类具有特殊病理生理基础的身心疾病，表现为与排便相关的腹痛和腹部不适，伴排便习惯改变或粪便性状改变。根据主要临床表现可将肠易激综合征分为腹泻型、便秘型、混合型和不定型。患病年龄多以中青年为主，女性多见，可伴有家族聚集倾向。临床上治疗 IBS 的常用药物包括：①解痉药；②促动力药；③功能调节药，如匹维溴铵和曲美布汀；④泻药，如乳果糖、聚乙二醇 4 000、硫酸镁、酚酞、甘油、液状石蜡；⑤止泻药，如洛派丁胺、复方地芬诺酯和双八面体蒙脱石；⑥微生态药，如地衣芽胞杆菌制剂、干酵母和乳酶生；⑦其他药，如二甲硅油等。

匹维溴铵[保(乙)]

Pinaverium Bromide

【适应证】用于肠易激综合征患者的腹痛、排便紊乱及肠道不适的对症治疗。

【注意事项】本品无明显的抗胆碱能作用，因此，本品可用于合并前列腺增生、尿潴留和青光眼的肠易激综合征者。

【禁忌证】对本品过敏者、儿童、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】本品耐受性良好，少数患者有腹部不适、腹痛、腹泻或便秘，偶见皮疹、瘙痒。

【用法与用量】口服：成人一次50 mg，一日3次，进餐时服用。必要时，一次剂量可达100 mg，一日可达300 mg。宜在进餐时用水吞服。应将本品整片吞下，切勿掰碎、咀嚼或含化药片。不要在卧位或睡前吞服药片。

【制剂与规格】匹维溴铵片：50 mg。

曲美布汀[保(乙)]

Trimebutine

【适应证】用于肠易激综合征，胃肠道运动功能紊乱引起的食欲减退、恶心、呕吐、腹胀、腹痛、腹泻和便秘等症状的改善。

【注意事项】出现皮疹等反应应停药观察。

【禁忌证】对本品过敏者、儿童、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】偶见便秘、腹泻、腹鸣、口渴、口内麻木感、困倦、眩晕、头痛、皮疹、心动过速、ALT及AST升高。

【用法与用量】口服：一次100～200 mg，一日3次。用药过程中如出现过敏反应，应即停药。

【制剂与规格】曲美布汀片：①100mg；② 200 mg。

地衣芽孢杆菌制剂[保(乙)]

Bacillus Licheniformobiogen

【适应证】用于急、慢性腹泻，各种肠炎及肠道菌群失调症的防治。

【注意事项】本品为活菌制剂，切勿将本品置于高温处，溶解时水温不宜高于40℃。服用本品时应避免与抗菌药物合用。

【禁忌证】对微生态制剂过敏史者禁用。

【不良反应】偶见大便干结、腹胀。大剂量服用可发生便秘。

【用法与用量】口服：成人一次0.5 g，一日3次，首剂加倍，儿童减半。

【制剂与规格】地衣芽孢杆菌胶囊：0.25 g（含2.5亿个活菌）。

枯草杆菌、肠球菌二联活菌制剂[保(乙)]

Live Combined Bacillus Subtilis and Enterococcus Faecium Granules with Multivitamines

【适应证】适用于消化不良、食欲缺乏、营养不良，肠道菌群紊乱引起的腹泻、便秘、腹胀、肠道内异常发酵、肠炎，使用抗生素引起的肠黏膜损伤等症。

【注意事项】(1) 冲服时的水温不得超过40℃。(2) ＜3岁的婴幼儿，不宜直接服用；直接服用时，注意避免呛咳。(3) 过敏体质者慎用。

【禁忌证】对微生态制剂过敏者禁用。

【不良反应】极罕见有服用本品腹泻次数增加的现象，停药后可恢复。

【用法与用量】口服：2岁以下儿童一次1 g，一日1～2次；2岁以上儿童一次1～2 g，一日1～2次。用低于40℃的水或牛奶冲服，也可直接服用。

【制剂与规格】枯草杆菌、肠球菌二联活菌多维颗粒剂：每袋1 g。

双歧三联活菌制剂[保(乙)]

Bifid Triple Viable

【适应证】用于肠道肠菌群失调引起的腹泻和腹胀，轻、中型急性腹泻及慢性腹泻。

【注意事项】本品不宜与抗菌药物同时服用；餐后半小时温开水送服。

【禁忌证】对微生态制剂过敏史者禁用。

【用法与用量】服用本品期间应停用其他抗菌药物。口服：成人一次420～840 mg，一日2～3次。1岁以下儿童一次105 mg，1～6岁一次210 mg，6～13岁一次210～420 mg，均为一日2～3次。婴幼儿可剥开胶囊倒出药粉或可将药片碾碎溶于温热（约40℃）牛奶中服用。幼儿可直接嚼服。

【制剂与规格】双歧三联活菌胶囊：210 mg（0.5×10^8个活菌）。

双歧三联活菌片：0.5 g（0.5亿个活菌）。

双歧三联活菌散剂：① 2 g；② 1 g。

双歧杆菌活菌胶囊：0.35 g（每粒含双歧杆菌活菌数量不低于 3.3×10^7 CFU，有效期内菌数量不低于 1.0×10^6 CFU）。口服：一次 0.35 ~ 0.7 g，一日 2 次，于早、晚餐后各服 1 次，儿童酌减；婴幼儿服用可取胶囊内药粉用凉开水调服。

二甲硅油[保（乙）]

Dimethicone

【适应证】用于各种原因所引起的胃肠道胀气，胃镜检查时作为消泡剂。

【注意事项】(1) 本品的水悬液应新鲜配置，于 3 日内用完。(2) 本品的气雾剂温度过低时不能使用，应加温后使用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】未见明显不良反应。

【用法与用量】口服。用于消除胀气，一次 50~100 mg，一日 3 次，连续 7~10 日。

【制剂与规格】二甲硅油片：每片含二甲硅油 25 mg 或 50 mg、氢氧化铝 40 mg 或 80 mg，为分散剂。

二甲硅油散：6%，为抗泡沫剂。

3.7 抗生素相关性肠炎及其药物治疗

抗生素相关性肠炎（antibiotic-associated colitis），又叫假膜性肠炎（pseudomembranous colitis），多由难辨梭状芽胞杆菌在肠道大量定植引起，多见于抗生素治疗后，易发生于年老体弱的重病患者及手术后患者。常常突然发病，但是病程迁延。抗生素相关性肠炎多见于克林霉素治疗后，但是很少抗生素不会出现这一不良反应。口服万古霉素（见 9.3.10）和硝基咪唑类（如甲硝唑、替硝唑），专用于治疗抗生素相关性肠炎，轻型可用微生态药（见 3.6），万古霉素更适于危重患者。严重病例还需要足够的营养支持治疗，包括输血浆、白蛋白或全血、补充电解质等。

3.8 急性腹泻及其药物治疗

急性腹泻（acute diarrhea）是指一日 3 次以上稀便，或大便量超过 200 g，其中水分占 80%，且病程在 1 ~ 2 周。引起急性腹泻的原因很多，较常见的原因是食入不洁食物及病毒感染。

急性腹泻治疗分为对症治疗和病因治疗。单纯胃肠炎致急性腹泻的首要治疗是防止或纠正水与电解质的损耗，可给予吸附药或收敛药或口服补液，这一点对婴幼儿和体弱者及老年人尤为重要。体液和电解质重度损耗者必须急诊入院，静脉补液治疗。此外，尚可应用抗动力药和解痉药及对因的抗菌药治疗。

3.8.1 吸附药和收敛药

白陶土

Kaolin

【适应证】用于腹泻，当合并感染或水电解质失衡时要慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】口服：白陶土合剂，一次 10 ~ 20 ml，每间隔 4 小时 1 次。

【制剂与规格】白陶土合剂：含白陶土（天然成分）20%，碳酸镁 5%，碳酸氢钠 5%。

双八面体蒙脱石[保（甲）]

Dioctahedral Smectite

【适应证】用于成人及儿童的急、慢性腹泻，食管、胃及十二指肠疾病引起的相关疼痛症状的辅助治疗，但不能作为解痉药使用。

【注意事项】(1) 本品可能影响其他药物的吸收，必须合用时在服用本品之前 1 小时服用其他药物。(2) 治疗急性腹泻应注意纠正脱水。

【不良反应】极少数患者可出现轻微便秘，减量后可继续服用。

【用法与用量】口服：成人，一次 3 g，一日 3 次，将 3 g 倒入 50 ml 温水中，摇均吞服用。1 岁以下幼儿，一日 3 g，分 2 次服用。1 ~ 2 岁幼儿，一次 3 g；2 岁以上幼儿，一次 3 g，均一日 1 ~ 2 次。急性腹泻者，首次剂量加倍。

【制剂与规格】双八面体蒙脱石散：3 g。

药用炭[保(甲)]

Medicinal Charcoal

【适应证】用于食物、生物碱等中毒及腹泻、腹胀气等。亦可作为腹部 X 线平片摄片前和腹部 B 超检查前用药。

【注意事项】服用药用炭可影响儿童营养。

【禁忌证】3 岁以下儿童如长期的腹泻或腹胀禁用本品。

【不良反应】长期或大量服用可引起便秘。

【用法与用量】口服：用于解毒，成人一次 30 ~ 100 g，混悬于温水中服下；用于肠道疾病，一次 1 ~ 3 g，一日 3 次，一日 3 ~ 9 g，餐前服用。

【制剂与规格】药用炭片：① 0.3 g；② 0.5 g。

碱式碳酸铋

Bismuth Subcarbonate

【适应证】用于缓解胃肠功能不全及吸收不良所引起的腹胀、腹泻等症状，高酸性的慢性胃炎、溃疡病，并与抗菌药物联合应用治疗与 Hp 感染有关的消化性溃疡，此外，本品糊剂外用治疗轻度烧伤、溃疡及湿疹等。

【注意事项】由细菌感染所致的肠炎，宜先控制感染后再使用本品。

【禁忌证】对本品过敏者、肠道高位阻塞性疾病、发热者、3 岁以下儿童。

【不良反应】(1) 用药期间舌苔和大便可呈黑色。(2) 偶可引起可逆性精神失常。(3) 大量及长期服用，可引起便秘和碱中毒。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 0.6 ~ 2.0 g，一日 3 次，餐前服用；3 ~ 5 岁儿童，一次 0.2 ~ 0.6 g，5 岁以上儿童，一次 0.6 ~ 1g，均一日 3 次，餐前服用。(2) 外用：涂敷患处，一日 2 次。

【制剂与规格】碱式碳酸铋片：① 0.3 g；② 0.5 g。

碱式碳酸铋糊剂：25%。

鞣酸蛋白

Albumine Tannate

【适应证】用于急性胃肠炎、非细菌性痢疾。

【注意事项】对急性腹泻者，如在服用本品 48 小时后临床症状无改善，应及时停用本品，改换其他治疗。

【禁忌证】有发热、便血的细菌性痢疾者，肠梗阻、便秘及胃肠胀气或严重脱水者、溃疡性结肠炎的急性发作期及由广谱抗菌药物所引起假膜性肠炎患者。

【不良反应】长期大量服用可引起便秘。

【用法与用量】口服：一次 1 ~ 2 g，一日 3 次。空腹服用。

【制剂与规格】鞣酸蛋白片：① 0.25 g；② 0.5 g。

3.8.2 抗动力药

抗动力药（antimotility drug）可以缓解急性腹泻症状，适用于治疗成年人无并发症的急性腹泻，而不适用于幼儿，一旦脱水，必须补偿体液和电解质。对于重症患者，补充体液和电解质是首要和重要的治疗。

洛哌丁胺[保(乙)]

Loperamide

【适应证】用于控制急、慢性腹泻的症状，也用于回肠造瘘术者，可减少排便量和次数，增加大便稠硬度。

【注意事项】(1) 本品不能作为有发热、便血的细菌性痢疾的治疗药物。对急性腹泻，如在服用本品 48 小时后临床症状无改善，应及时停用本品，改换其他治疗。(2) 肝功能障碍者慎用，可致体内药物相对过量，应注意中枢神经系统中毒反应。(3) 妊娠期妇女慎用，哺乳期妇女尽量避免使用。(4) 5 岁以下的儿童不宜使用本品的胶囊剂治疗。5 岁以上的儿童减半量。腹泻患者常伴有水和电解质丧失，尤其是儿童，用本品治疗时应注意同时补充水和电解质的治疗措施。(5) 若有过量时，可能出现中枢神经抑制症状，如木僵、调节功能紊乱、嗜睡、缩瞳、肌张力过高、呼吸抑制等以及肠梗阻。可用纳洛酮作为解毒剂，由于本品的作用时间长于纳洛酮 1 ~ 2 小时，须至少监察 48 小时。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 肠梗阻患者、便秘及胃肠胀气或严重脱水

的患者、溃疡性结肠炎的急性发作期。(3) 由应用广谱抗菌药物引起假膜性肠炎、细菌性小肠结肠炎者。

【不良反应】偶见口干、嗜睡、倦怠、头晕、恶心、呕吐、便秘、胃肠不适和过敏反应。

【用法与用量】口服：成人初始剂量一次 2 ~ 4 mg，以后根据维持大便正常情况调节剂量，一日可用 2 ~ 12 mg。成人最大剂量不超过一日 16 mg，儿童不超过一日 8 ~ 12 mg。

【制剂与规格】洛哌丁胺胶囊：2 mg。

地芬诺酯

Diphenoxylate

【适应证】用于急、慢性功能性腹泻，慢性肠炎。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女长期服用本品可引起新生儿的戒断症状及呼吸抑制。(2) 儿童服用本品一定要十分慎重，因易出现迟发性地芬诺酯中毒，且儿童对本品的反应也有很大的变异性。使用本品时，必须考虑患儿营养状况和药物的水解度。2 ~ 13 岁儿童应使用本品溶液剂而不要使用片剂。(3) 下列情况慎用，如慢性肝病患者（可诱发肝性脑病）、正在服用成瘾性药物者、腹泻早期或腹胀者、哺乳期妇女。(4) 用药前、后和用药期间应监测粪便黏度及腹泻是否停止；水、电解质平衡；呼吸抑制，以免引起中毒。(5) 地芬诺酯是哌替啶的衍生物，具有阿片样的作用，长期应用可产生药物成瘾性。(6) 本品不能用作细菌性痢疾的基本治疗药物。可与抗菌药物合用治疗菌痢，以帮助控制腹泻症状。

【禁忌证】(1) 2 岁以下儿童。(2) 青光眼者、严重肝病、肝硬化、梗阻性黄疸、脱水患者。(3) 对地芬诺酯或阿托品过敏者。(4) 与假膜性小肠结肠炎或产肠毒素的细菌有关的腹泻者。

【不良反应】成年人服用常规剂量，不良反应轻而少见。偶见口干、恶心、呕吐、头晕、头痛、嗜睡、失眠、抑郁、烦躁、皮疹、腹胀及肠梗阻等，减量或停药后即消失。儿童对本品比较敏感，可能出现呼吸抑制等不良反应。

【用法用量】口服：成人，一次 2.5 ~ 5 mg，一日 2 ~ 3 次。腹泻得到控制时即可减少剂量。

【制剂与规格】地芬诺酯片：2.5 mg。

复方地芬诺酯片：每片含地芬诺酯 2.5 mg、硫酸阿托品 0.025 mg，一次 1 ~ 2 片，一日 2 ~ 4 次，餐前服用；儿童，口服，2～5 岁，一次 1 片，一日 2 次；6 ~ 8 岁，一次 1 片，一日 3 次；8 ~ 12 岁，一次 1 片，一日 4 次。

复方地芬诺酯溶液：每 5 ml 含地芬诺酯 2.5 mg，硫酸阿托品 0.025 mg。儿童，口服，2 ~ 5 岁，一次用溶液 5 ml，一日 2 次；5 ~ 8 岁，一次用溶液 5 ml，一日 3 次；8 ~ 12 岁，一次用溶液 5 ml，一日 4 次。

复方樟脑酊[保(乙)]

Compound Camphor Tineture

【适应证】 用于干咳及腹泻。

【注意事项】本品可致依赖性，不应持续服用。儿童慎用。

【禁忌证】严重肝功能不全、肺源性心脏病、支气管哮喘、婴儿、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【用法与用量】口服：一次 2 ~ 5ml，一日 3 次。

【制剂与规格】复方樟脑酊：每 1 ml 含樟脑 3 mg、阿片酊 0.05 ml、苯甲酸 5 mg、八角茴香油 0.003 ml。

3.8.3 抗分泌药

消旋卡多曲[保(乙)]

Racecadotril

【适应证】成人急性腹泻的对症治疗。

【注意事项】如患者出现脱水现象，本品应与口服补液盐合用。

【禁忌证】由于未进行过专门的临床试验，孕妇，哺乳期妇女及儿童不应使用本品。

【不良反应】偶见嗜睡、皮疹和便秘等。消旋卡多曲不通过血脑屏障，因此对中枢神经系统没有作用。

【用法与剂量】口服：成人，治疗急性腹泻，首次服药可在任何时间开始服用 1 粒胶囊（100 mg），之后每次在 3 次主餐前

服用1粒。服用消旋卡多曲不排除在必要的情况下进行补水。连续用药不超过7日。

【制剂】消旋卡多曲胶囊：100 mg。

3.8.4 解痉药

在治疗与腹泻相关的腹部痉挛时可以应用解痉药（见3.1.4.1），但不能作为腹泻的主要治疗药物。抗痉挛和抗呕吐药应该避免用于幼儿的胃肠炎，因为疗效较差且易引发不良反应。

3.8.5 抗菌药

单纯胃肠炎一般不需用抗菌药物，因为即使不用抗菌药物病情通常也能迅速缓解，而且病毒也是感染性肠炎的常见病原。然而，全身性细菌感染所致的腹泻必须给予适当的系统性治疗。

3.9 便秘及其药物治疗

便秘（constipation）是指排便次数减少（量化指标为便次＜3次／周，更有意义的是比以前减少），排便困难及粪便干结等症状，而不是一种疾病。便秘多是功能性的，少数是器质性疾病所继发的。

便秘治疗的目的是改善症状，消除病因，恢复正常肠动力和排便的生理功能。

对于器质性疾病继发的便秘，应重视器质性疾病的诊断及治疗，可同时对便秘症状给予相应处理。对于无报警症状（如消瘦、贫血、便血、腹痛、腹部包块等）以及全身其他器质性疾病存在的证据或经过检查除外相关器质性疾病而诊断为功能性便秘者，治疗原则是首先对患者进行良好的精神、心理状态，合理的饮食结构和良好的排便习惯的培养。除特殊情况，如冠心病不能用力排便者或有痔出血风险者，一般不首先使用泻药，更不能滥用泻药。对于以上措施仍不能解除便秘的患者，可选择药物治疗。

治疗便秘的药物包括容积性泻药、渗透性泻药、刺激性泻药、润滑性泻药（粪便软化剂）、肠道清洗剂及胃肠动力药。有的药物不只属于一种类型，而为混合型。关于药物的选择需要强调个体化，可单一用药，也可联合用药。

对于一般的慢性便秘患者，最好选容积性泻药（见3.9.1）或渗透性泻药（见3.9.2），而不要长期应用刺激性泻药（见3.9.3）。因为刺激性泻药可造成泻剂性结肠，引起药物剂量增加而疗效降低，加重便秘。但可以偶尔或必要时使用。

对于有轻度排便不尽感的患者，可以短期应用刺激性泻药（见3.9.3），但应警惕肠绞痛、直肠粪便嵌塞、大便失禁。

对于年老体弱多病的慢性便秘患者，需长期规律应用泻药，最好不要间断，以维持正常排便，预防粪便嵌塞。

对于妊娠期妇女，在调整饮食和生活习惯后仍不能解除便秘时，可以使用中等剂量吸收较少的泻药。推荐使用容积性泻药和渗透性泻药，如乳果糖。如有需要刺激肠道蠕动时，尚可使用刺激性泻药或胃肠动力药。

对于儿童，如果大便延迟3日以上可能造成排干便时疼痛，并导致肛裂、肛周痉挛，最终引起不敢排便的条件反射，因此应该在经验丰富的儿科专家指导下应用泻药，父母和看护人需要调整泻药的剂量，以建立规律的排便习惯，保持粪便成形，不干结，无排便不适感。发生粪便嵌塞的儿童，可以口服聚乙二醇制剂以软化、清除粪便。直肠给药可能有效，但常会增加儿童痛苦而拒绝。如果经聚乙二醇治疗嵌塞粪便仍未排出，可以在深度镇静的情况下进行灌肠。严重粪便嵌塞或者恐惧的儿童，比较适宜进行麻醉下手工排出嵌塞的粪便。

3.9.1 容积性泻药

容积性泻药（bulk laxative）通过增加大便量，刺激肠蠕动，从而缓解便秘症状，对于以粪便干结为主者效果较好，但是药物一般需要几天才能发挥作用。

容积性泻药可用于结肠造口术、回肠造口术、痔疮、肛裂、便秘型肠易激综合征。但必须保证充分的水分摄入，以防肠梗阻的发生。粗加工的麸皮是最好的容积性泻药，可以配合食物或果汁使用。精加工的麦麸虽然口感好，但是吸水性比较差。燕麦麦麸也可以作为容积性泻药。

欧车前亲水胶

Psyllium Hydrophilic Mucilloid

【适应证】(1) 便秘及相关疾病，如功能性便秘、肠易激综合征、憩室病、痔疮、肛裂、肛肠手术及其他外科手术后，维持正常的排便功能。(2) 非特异性腹泻。(3) 高胆固醇血症。(4) 非胰岛素依赖型糖尿病的辅助治疗。

【注意事项】(1) 应保持足够水分摄入，以防肠梗阻和食管阻塞。(2) 不能在睡前服用。(3) 对老年人、体弱、肠道狭窄、胃肠动力不足者应认真监护。(4) 橙味剂型含苯丙氨酸，对苯丙酮尿症者慎用。

【禁忌证】(1) 原因不明的腹痛、炎症性肠道病变、肠梗阻、肠麻痹、胃肠出血及粪便嵌塞。(2) 对本品过敏者。(3) 妊娠及哺乳期妇女、婴幼儿。(4) 长期卧床者或吞咽困难者。

【不良反应】常见腹胀、恶心、肠胀气、肠梗阻、粪便嵌塞、肠绞痛等，宜从小剂量开始可避免，坚持服用症状可消失。对车前子敏感者，吸入或摄入本品可能会引起过敏反应。亦有支气管痉挛、鼻炎等变态反应。

【用法与用量】口服：成人，一次6 g，一日1～3次，以300 ml水搅匀后，于餐后半小时服用。

【制剂与规格】欧车前亲水胶散：6 g。

3.9.2 渗透性泻药

渗透性泻药主要通过将身体的水分吸到肠道或防止大便中的水分被吸收来增加肠道中的水分。在使用时需补充水分，以减少渗透性泻药使人体脱水的不良反应。

乳果糖是半合成双糖，在胃肠道中不被吸收，导致渗透性腹泻。它可以降低粪便pH，抑制产氨细菌的增殖，因而可用于治疗肝性脑病。

聚乙二醇是无活性的乙二醇多聚体，在胃肠道中不被吸收，通过增加局部渗透压，使水分保留在结肠肠腔内。

盐类泻药如镁盐，适于需快速清洁肠道的患者，需保证液体摄入。偶尔使用效果比较好，防止滥用。禁止使用钠盐，因为其可能引起某些敏感患者的钠水潴留。

乳果糖 [保（乙）]

Lactulose

【适应证】用于慢性或习惯性便秘，并预防和治疗各种肝病引起的高血氨症以及高血氨所致的肝性脑病。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如妊娠初始3个月妇女、乳果糖不耐受者、糖尿病患者。(2) 本品疗效有个体差异性，需调节剂量。

【禁忌证】(1) 本品过敏者。(2) 胃肠道梗阻和急腹症者。(3) 对乳糖或半乳糖不耐受者、乳酸血症者。(4) 尿毒症和糖尿病酸中毒者。

【不良反应】偶见腹部不适、胀气或腹痛；剂量大时偶见恶心、呕吐。长期大量使用致腹泻时可出现水电解质失衡。不良反应在减量或停药不久后消失。

【用法与用量】(1) 用于便秘，口服，成人，一次5～10 g，一日1～2次；6～12岁儿童，一次5 g，1～5岁儿童，一次3 g，婴儿，一次1.5 g，均一日1～2次。(2) 用于肝性脑病：①成人常规用药。口服，起初1～2日，一次10～20 g，一日2～3次，后改为一次3～5 g，一日2～3次，以一日排软便2～3次为宜。灌肠，200 g加适量水，保留或流动灌肠30～60分钟，每4～6小时1次。②儿童和婴儿，初始量为1.7～6.7 g，分次给予；年龄较大的儿童和青少年，一日27～60 g，后调整剂量到每天2～3次软便。

【制剂与规格】乳果糖粉：① 5 g；② 100 g。

乳果糖溶液：① 10 ml : 6.7 g；② 100 ml : 66.7 g；③ 300 ml : 200 g。

乳果糖口服溶液：① 10 ml : 5 g；② 100 ml : 50 g；③ 15 ml : 10 g。

聚乙二醇4000 [保（乙）]

Macrogol 4000

【适应证】用于成人及8岁以上儿童（包括8岁）便秘的症状治疗。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 出现水、电解质紊乱者停药。(3) 建议不要长期使用，儿童应为短期治疗，疗程最好不超过3个月，可配合其他

通便措施。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 炎症性器质性肠病（溃疡性结肠炎、克罗恩病）、肠梗阻、肠穿孔、胃潴留、消化道出血、中毒性肠炎、中毒性巨结肠和肠扭转患者。(3) 未确诊的腹痛。

【不良反应】因为在消化道内不被吸收或吸收量极少，潜在毒性极低。可能会导致腹泻，少数甚至腹胀、腹痛，恶心，停药后 24 ~ 48 小时将恢复正常。重新再服用小剂量即可。罕有过敏反应，如皮疹、荨麻疹和水肿。特例报道有过敏性休克。

【用法与用量】口服：成人和 8 岁以上儿童一次 10 g，一日 1 ~ 2 次；或一日 20 g，一次顿服，将每袋本品溶解在一杯水中服用。

【制剂与规格】聚乙二醇 4 000 粉剂：每袋 10 g。

聚乙二醇电解质散：每盒 137.5 g，由 A、B、C 各 1 包组成，A 包含氯化钠、无水硫酸钠混合物 (14.3 g)，B 包含氯化钾、碳酸氢钠混合物 (4.85 g)，C 包含聚乙二醇 4 000 (118 g)。

复方聚乙二醇电解质散：每盒 69.56 g。每盒由 A、B、C 各 1 包组成，A 包含氯化钾 0.74 g、碳酸氢钠 1.68 g，B 包含氯化钠 1.46 g、硫酸钠 5.68 g，C 包含聚乙二醇 4 000　60 g。

配制方法：聚乙二醇电解质散和复方聚乙二醇电解质散，两种散剂均加水配成 1 000 ml 溶液，即成等渗性全肠灌洗液。用于术前肠道清洁准备，肠镜、钡剂灌肠及其他检查前的肠道清洁准备。口服：①溶液配制方法，将 1 盒（内含 A、B、C 各 1 小包）内各包药粉一并倒人杯中，加温开水至 1 000 ml，搅拌至求之过急全溶解，即可服用。②术前肠道清洁准备，剂量为 3 000～4 000 ml，首次服用 600 ~ 1 000 ml 以后每隔 10 ~ 15 分钟服用 1 次，一次 250 ml，直至服完或直至排出水样清便；肠镜、钡剂灌肠及其他检查前的肠道清洁准备，剂量为 2 000～3 000 ml，服法相同。

聚桂醇 [保(乙)]

Lauromacrogol

【适应证】用于内镜下食管曲张静脉出血的急诊止血及曲张静脉的硬化治疗。

【注意事项】(1) 切记勿注入动脉血管。(2) 因严格按操作规程做好技术前准备及术后护理。(3) 以下情况根据病情而定：①急性严重心脏病，如心内膜炎、心肌炎、心力衰竭和高血压。经过治疗病情稳定，可进行硬化疗法；②发热；③急性肺部疾病包括呼吸困难时（如支气管哮喘）。

【禁忌证】(1) 患者处于休克状态或对本品过敏者禁用。(2) 在妊娠头 3 个月和妊娠第 36 周后禁用。

【不良反应】可出现暂时胸痛、心功能降低、吞噬困难、胃灼热、反酸、便秘；也可出现局部组织坏死和食管溃疡（有时伴出血、个别有穿孔）、食管狭窄、胸腔积液等；偶见暂时性虚脱、头晕、呼吸困难、胸闷、恶心、视力障碍、局部感觉损害和金属味觉。

【用法与用量】(1) 曲张静脉活动出血时：采用环绕出血点 + 出血点处直接注射技术止血；一个出血点局部用量 10 ml 左右，最大剂量不超过 15 ml。(2) 曲张静脉硬化治疗：采用单纯静脉内注射硬化技术，每次注射 2 ~ 4 个点，一次注射剂量 3 ~ 15 ml；采用静脉旁 – 静脉内联合注射硬化技术时，以静脉注射为主，从距食管齿状线 1 ~ 2 cm 处开始逆行性硬化疗，静脉旁黏膜下多点注射，每点注射量以注射局部出现灰白色隆起为标准，通常用量不超过 1 ml，静脉内注射，每点 1 ~ 2 ml；一次硬化治疗总剂量不超过 35 ml。(3) 曲张静脉活动出血止血后，其他可见曲张静脉：采用静脉旁 – 静脉内联合注射技术硬化治疗，止血和硬化治疗的总剂量通常不超过 35 ml。曲张静脉系统硬化治疗 4 ~ 6 周完成：首次治疗后与第二次治疗间隔不超过 1 周，以后每周 1 次，直到可见曲张静脉完全消失。

【制剂与规格】聚桂醇注射液：10 ml : 100 mg。

硫酸镁 [基(基)，保(甲)]

Magnesium Sulfate

【适应证】用于导泻、肠道清洗；十二指肠引流及治疗胆绞痛。

【注意事项】(1) 肾功能不全者慎用。

(2) 儿童及老年人慎用。(3) 呼吸系统疾病患者，特别是呼吸功能不全者慎用。(4) 严重心血管疾病患者慎用。(5) 服用中枢抑制药中毒需导泻时，应避免使用硫酸镁，改用硫酸钠。(6) 本品的致泻作用一般在服药后 2 ~ 8 小时出现，故宜早晨空腹服药，并同时大量饮水以加强导泻作用，防止脱水。

【禁忌证】急腹症、肠道失血、妊娠及经期妇女。

【不良反应】可能引起嗳气、腹痛、食欲减退等。连续服用硫酸镁可引起便秘，部分患者可出现麻痹性肠梗阻，停药后好转。

【用法与用量】口服：①用于导泻，一次 5 ~ 20 g，一日 1 次，用水 100 ~ 400 ml 溶解后顿服。②用于利胆，服用 33% 的溶液剂，一次 10 ml，一日 3 次。

【制剂与规格】硫酸镁溶液：100 ml : 33 g。

(其他见 11.5)

开塞露[基(基), 保(甲)] 本品含山梨醇 45% ~ 50% (g/g)，硫酸镁 10% (g/ml)，成人剂量一次 20 ml，儿童一次 10 ml。

3.9.3 刺激性泻药

刺激性泻药包括比沙可啶、蒽醌类、番泻叶、丹蒽醌。由于在动物肿瘤研究中发现丹蒽醌具有致癌性和遗传毒性，所以其适应证比较局限。有些刺激性比较强的泻药如鼠李、蓖麻油已基本不用。

刺激性泻药能够增加肠道蠕动，常引起腹痛，故肠梗阻患者应禁用。过度使用刺激性泻药会引起腹泻以及相关不良反应，如低钾血症。

甘油栓剂具有温和的刺激作用，局部作用于直肠。

拟副交感神经药，如新斯的明，能够增强胃肠副交感神经活性，促进胃肠蠕动，但因为其胃肠不良反应，已经很少使用。在使用之前必须排除器质性梗阻，在肠道吻合术后不能立即使用。

比沙可啶

Bisacodyl

【适应证】用于便秘的治疗，腹部 X 线检查或内镜检查前以及手术前后清洁肠道。

【注意事项】(1) 本品有较强刺激性，应避免将本品吸入或与眼睛、皮肤黏膜接触。(2) 为避免胃肠道刺激，应用肠溶片在服药时不得咀嚼或压碎，(3) 进餐 1 小时内不宜服用本品，服药前 2 小时不得服牛奶或抗酸药。(4) 不宜长期使用（不超过 7 天）。(5) 妊娠期妇女慎用，哺乳期妇女在用药期间应停止哺乳。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 急腹症（阑尾炎、肠梗阻和胃肠炎等）、炎症性肠病、严重水、电解质紊乱者。(3) 6 岁以下儿童不建议用此药；新生儿禁忌直肠给药。

【不良反应】偶见明显的腹部绞痛，停药后即消失；直肠给药有时有刺激性，反复应用可能引起直肠炎；可引起过度腹泻；可出现尿色异常和低钾血症。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 5 ~ 10 mg，一日 1 次。(2) 直肠给药：一次 10 mg，一日 1 次。造影检查和手术前服用，手术前一日晚上口服或直肠用栓 10 ~ 20 mg，早上再服 10 mg（片剂起效时间 10 ~ 12 小时，栓剂起效时间 20 ~ 60 分钟）。

【制剂与规格】比沙可啶片：① 5 mg；② 10 mg。

比沙可啶栓：① 5 mg；② 10 mg。

酚酞[基(基), 保(甲)]

Phenolphthalein

【适应证】用于治疗便秘，也可在结肠镜检查或 X 线检查时用作肠道清洁剂。

【注意事项】(1) 幼儿及妊娠期妇女慎用。(2) 避免过量或长期应用。(3) 药物过量处理应马上洗胃，并给予药用炭。(4) 禁用导泻药。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 阑尾炎、肠梗阻、直肠出血未明确诊断的患者、充血性心力衰竭和高血压、粪块阻塞者。(3) 婴儿和哺乳期妇女。

【不良反应】偶见肠绞痛、出血倾向；罕见过敏反应。

【用法与用量】口服：成人一日 50 ~ 200 mg，根据患者情况而增减；1 ~ 2.5

岁儿童，一日 15 ~ 20 mg，2.6 岁以上儿童，一日 30 ~ 60 mg。一般应睡前顿服，服药后约 8 小时排便。

【制剂与规格】酚酞片：① 50 mg；② 100 mg。

蓖麻油 [保（乙）]

Oleum Rinii

【适应证】用于外科手术前或诊断检查前清洁肠道之用。用于器械润滑。

【注意事项】不宜作为治疗便秘长期用药；忌与脂溶性驱肠虫药同用。

【禁忌证】妊娠及经期妇女。

【不良反应】泻后可有短期便秘，常见不良反应为恶心、呕吐等。蓖麻油在小肠内可引起形态学改变，并改变黏膜的通透性。可发生腹痛、脱水和电解质失衡。

【用法与用量】口服。成人一次 10 ~ 20 ml，总量不超过 60 ml；儿童一次 5 ~ 15 ml，< 2 岁的婴幼儿，一次 1 ~ 5 ml。

3.9.4 润滑性泻药（粪便软化药）

甘油 [保（乙）]

Glycerol

【适应证】用于便秘。

【用法与用量】直肠给药。栓剂，一次 1 粒塞入肛门（成人用 3 g，儿童用 1.5 g），对儿童及年老体弱者较为适宜。灌肠剂，将开口的容器插入肛门。液体挤入直肠，成人，一次 20 ml；儿童一次 10 ml。可用本品 50% 溶液灌肠。清洁肠道。

【制剂与规格】甘油栓剂：① 1.5 g；② 3 g。

甘油灌肠剂：110 ml。

开塞露（含甘油）：① 10 ml，② 20 ml。

液状石蜡 [保（乙）]

Liquid Paraffin

【适应证】用于肠梗阻、肠粪块嵌塞、便秘，也用于器械润滑。

【注意事项】本品不可久用，因口服可妨碍脂溶性维生素和钙、磷的吸收，并有吸入肺部的危险。在摄用后保持直立位至少 2 小时以减少脂肪性肺炎的危险。对有吞咽异常者不宜给予口服液状石蜡。

【禁忌证】婴幼儿禁用。

【不良反应】曾有报道，在全身性吸收液状石蜡后在肝、脾或肠系膜淋巴结内发生异物肉芽肿或液状石蜡瘤。

【用法与用量】口服，成人一次 15 ~ 45 ml，一日 2 次；6 岁以上儿童，一次 10 ~ 15 ml，睡前服用。

3.9.5 肠道清洗药

肠道清洗药仅仅用于结肠手术、结肠镜检查、影像学检查前的肠道清洗，以保证肠道中无固体内容物，不能用于便秘治疗。

3.10 肛门和直肠疾病及其药物治疗

肛门或肛周瘙痒、疼痛、脱皮常见于痔疮、肛瘘、直肠炎患者。肛门和直肠这些病变最好使用刺激性小的软膏和栓剂，并采取调整饮食，如多渣食物和容积性泻药（见 3.9.1）避免大便干结。这些可以作为使用糖皮质激素或柳氮磺吡啶治疗的直肠型溃疡性结肠炎患者的辅助治疗。

缓解痔疮症状的药物多含有少量的收敛剂，能够缓解痔疮症状，如次没食子酸铋、氧化锌、金缕梅。许多药物还含有一些润滑剂、血管收缩剂和少量抗菌药。

局麻药可以缓解痔疮和瘙痒引起的疼痛，但是缺乏有力证据。排便前使用利多卡因软膏可以缓解肛裂引起的疼痛。其他局麻药有丁卡因、辛可卡因、普莫卡因，但是刺激性较强。局麻软膏中的麻药可以经直肠黏膜吸收，因而禁止过度使用，特别是婴儿和儿童。含有局麻药的局部作用制剂只能在几天内短期应用，否则易致肛周皮肤过敏。

在除外肛周真菌感染后，如有必要可使用含有麻醉药或糖皮质激素的局部作用制剂。肛周真菌感染可口服或局部使用制霉菌素。

肛裂的治疗需要软化大便，比如通过增加膳食纤维，如麦麸或者使用容积性泻药。短期应用局麻药可能有助于缓解症状。或使用局部作用的硝酸盐。如果上述治疗无效，应该住院由专科医师治疗，如行

手术。

复方角菜酸酯 [保（乙）]

Compound Carraghenates

【适应证】用于痔疮及其他肛门疾病引起的疼痛、肿胀、出血和瘙痒的对症治疗；亦可用于缓解肛门局部手术后的不适。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 使用本品 7 日后，如症状尚未缓解，请及时就医。(3) 使用本品时，宜先洗净患处，使用期间注意保持良好的饮食习惯。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】用药部位皮肤可能会略感不适。

【用法与用量】外用：塞肛门内约 2 cm 处，一次 1 枚，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】复方角菜酸酯栓：3.4 g，每枚含角菜酸酯 0.3 g、二氧化钛 0.2 g、氧化锌 0.4 g。

地奥司明 [保（乙）]

Diosmin

【适应证】用于急性痔疮发作引起的各种症状，静脉淋巴功能不全相关的各种症状（腿部沉重、疼痛、晨起酸胀不适感）。

【注意事项】应用本品治疗须是短期的，不能替代处理肛门疾病所需的其他特殊治疗。如症状不能迅速消除，应肛肠病专科诊治。治疗期间不推荐母乳喂养。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】有少数轻微胃肠反应和自主神经障碍的报道，但未必须中断治疗。

【用法与用量】口服：常用剂量为一日 2 片；当用于急性痔疮发作时，前 4 日一日 6 片，以后 3 日一日 4 片，并将一日剂量平均分为 2 次于午餐、晚餐时服用。

【制剂与规格】地奥司明片：500 mg（内含地奥司明 450 mg、橙皮苷 50 mg）。

草木犀流浸液 [保（乙）]

Melilotus Extract

【适应证】用于：①治疗因创伤、外科手术等引起的软组织损伤肿胀；②治疗炎性外痔、血栓性外痔、各期内痔、混合痔引起的出血、疼痛、肿胀、瘙痒等。

【注意事项】妊娠及哺乳期妇女慎用。

【不良反应】尚未发现不良反应。

【用法与用量】口服：成人一次 1 ~ 4 片，一日 3 次。用量可根据年龄及症状而增减。

【制剂与规格】草木犀流浸液片剂：400 mg。

鱼肝油酸钠 [保（甲）]

Morrhuate Sodium

【适应证】作为血管硬化剂，用于血管瘤、静脉曲张、内痔、颞颌关节病（脱位或半脱位者），也用于妇科、外科等创面渗血和出血。

【注意事项】(1) 偶有严重过敏反应，注射前应先做过敏试验。过敏体质者慎用。(2) 本品在气候较冷时，如有微小固体物质形成，可微微加热，使之溶解。(3) 妊娠及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】(1) 有深部静脉血栓形成者禁用。(2) 急性感染、慢性全身性疾病、心脏功能不全的患者禁用。

【不良反应】偶有引起皮疹等不良反应，也可引起注射区疼痛、肿胀不适。

【用法与用量】局部注射：常用量，一次 0.5 ~ 5 ml；极量，一次 5 ml。①静脉曲张：第一次注射 5% 溶液（内含 2% 苯甲醇作为局部止痛药）0.5 ~ 1 ml 于静脉曲张腔内。如无不良反应，24 小时以后可继续注射 0.5 ~ 2 ml（一般为 1 ml），一日不超过 5 ml，每隔 3 ~ 5 日在不同部位注射。②血管瘤，根据肿瘤大小可多点注射。③内痔：一次注射 5% 的溶液 0.5 ml，注人痔核上部，一周 1 次。

【制剂与规格】鱼肝油酸钠注射液：① 1 ml ∶ 0.05 g； ③ 2 ml ∶ 0.1 g；② 5 ml ∶ 0.25 g；④ 10 ml ∶ 0.5g 。

3.11 急性胰腺炎及其药物治疗

急性胰腺炎（acute pancreatitis）是由多种病因引起胰酶在胰腺内激活，引起以胰腺局部炎症反应为主要特征，伴或不伴有其他器官功能改变的疾病。临床分两型，轻型急性胰腺炎（MAP）和重型急性胰腺炎（SAP），后者主要指急性胰腺

炎伴有脏器功能障碍，或出现坏死、脓肿或假性囊肿等局部并发症，或两者兼有。急性胰腺炎的治疗目的主要包括抑制胰液分泌；对症支持治疗；并发症的监测和治疗。

发病初期治疗包括纠正水电解质紊乱，支持治疗，防止局部及全身并发症。基本治疗措施包括：①饮食控制，发病后即应该禁食，当腹痛症状完全缓解，腹部压痛体征消失，肠鸣音恢复正常，可先进无脂流食，逐步恢复饮食。②胃肠减压，严重腹胀、麻痹性肠梗阻的患者可予胃肠减压治疗。③补液，积极的静脉液体补充对于纠正低血容量至关重要，包括补充血容量、保持水、电解质和酸碱平衡。补液量依据基础需要量和流入组织间隙的液体决定，注意补充胶体液和补充微量元素、维生素。④镇痛，可予哌替啶，不推荐使用吗啡和胆碱能受体拮抗药，如山莨菪碱。⑤抗菌药物，非胆源性MAP不推荐使用抗生素，对胆源性急性胰腺炎应常规使用抗生素。坏死性胰腺炎并发热、白细胞升高、和（或）器官衰竭者，进行培养同时（包括CT引导经皮胰腺抽吸）予以恰当的抗生素是合理的，如未发现感染源，则停用抗生素。抗生素使用原则为抗菌谱为革兰阴性和厌氧菌为主，脂溶性强，有效通过血-胰屏障。一线药有甲硝唑和喹诺酮类药。严重时可予亚胺培南-西司他丁。⑥营养支持，MAP可予全胃肠外营养（TPN）。SAP一旦明确患者数周内不能经口摄食，则应开始营养支持。可予肠内营养（EN）。⑦预防和治疗肠道衰竭，谷氨酰胺保护肠道黏膜、调节肠道菌群药物。⑧抑制胰液分泌，生长抑素或其长效类似物奥曲肽。⑨抑制胰酶药，加贝酯或抑肽酶，起抑制蛋白酶作用。氟尿嘧啶一日0.1～0.5g静脉滴注，抑制胰蛋白酶。⑩ H_2受体拮抗药和PPI抑制胃酸分泌间接抑制胰液分泌。⑪抗炎性因子药物，如Lexipafan，是肿瘤坏死因子拮抗药，使用于SAP全身炎症反应明显者。⑫鼻胆管引流或内镜下括约肌切开术（EST），对感染性胰腺坏死、胰腺脓肿应手术治疗。

加贝酯[保(乙)]

Gabexate Mesilate

【适应证】用于急性轻型（水肿型）胰腺炎的治疗，也可用于急性出血坏死型胰腺炎的辅助治疗。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女慎用。(2) 本品在使用过程中应密切观察，谨防过敏，一旦发现应及时停药或抢救。(3) 勿将药液注入血管外。(4) 多次使用应更换注射部位。(5) 药液应新鲜配制，随配使用。

【禁忌证】有药物过敏史者、儿童、妊娠期妇女。

【不良反应】少见出现注射部位疼痛、皮肤发红等刺激症状及轻度浅表静脉炎。偶见皮疹、面部潮红、过敏。极个别病例可能发生胸闷、吸吸困难、血压下降等过敏性休克现象。

【用法与用量】静脉滴注：一次100 mg，治疗开始3日一日剂量300 mg，症状减轻后改为一日100 mg。疗程6～10日，先以5 ml注射用水注入装有加贝酯冻干粉针瓶内，待溶解后即移注于5%葡萄糖注射液或复方氯化钠注射液500 ml中。滴速不宜过快，应控制每小时1 mg/kg以内，不宜超过每小时2.5 mg/kg。

【制剂与规格】注射用甲磺酸加贝酯：0.1 g。

生长抑素[保(乙)]

Somatostatin

【适应证】(1) 严重、急性胃及十二指肠溃疡出血。(2) 急性糜烂性或出血性胃炎。(3) 胰腺手术后的术后并发症的预防。(4) 严重急性食管静脉曲张出血。(5) 胰、胆和肠瘘的辅助治疗。(6) 糖尿病酮症酸中毒的辅助治疗。

【注意事项】(1) 糖尿病患者慎用。(2) 用药前后及用药时应检查或监测血糖，由于本品抑制胰岛素和胰高血糖素的分泌，所以对胰岛素依赖型糖尿病患者在使用时须小心，这些患者可能会发生短暂的低血糖或2～3小时后出现高血糖，故使用时应每隔3～4小时测试一次血糖浓度。(3) 本品与其他药物的不相容性未经测试，所以在注射或静滴时，应单独应用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 儿童、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 常见不良反应：恶心、呕吐；少见眩晕、面部潮红、腹痛、腹泻和血糖轻微变化。(2) 消化系统：出现恶心、呕吐、腹泻和腹部痉挛性疼痛。(3) 血液系统：静脉用药期间出现白细胞增多。(4) 神经、精神系统：有输注本品时发生头痛的报道，但罕见。(5) 心血管系统：①有报道在输注本品期间出现心律失常，如室性期前收缩，但罕见。②静脉给予本品期间，正常人的血压和脉搏有短暂的升高，但在高血压患者中，血压反而降低。这些发现的临床意义还不清楚。(6) 代谢及内分泌系统①由于本品抑制胰岛素及胰高血糖素的分泌，在治疗初期，可能会导致短暂的血糖水平下降。②有报道某些非糖尿病患者用药时出现糖耐量异常；但也有研究报道胰岛素依赖型糖尿病患者用本品治疗后胰岛素的需要量下降，血糖控制改善。③有发生危及生命的水潴留伴低钠血症的个案报道。(7)呼吸系统：曾有静脉用药（250 μg）的患者出现呼吸困难伴全身广泛烧灼感的报道，但这一反应是否确为本品引起尚不肯定。(8) 皮肤：个案报道患者静脉注射本品 20 小时后出现红皮病，停药后症状消失。

【用法与用量】静脉注射：(1) 用于严重的上消化道出血，包括食管静脉出血。初始 250 μg 缓慢静脉注射（3 ~ 5 分钟），而后以每小时 250 μg 静脉滴注。止血后应连续用药 48 ~ 72 小时。(2) 对胰胆肠瘘的辅助治疗，每小时 250 μg 静脉连续滴注给药，直到瘘管闭合，闭合后继续应用 1 ~ 3 日，然后逐渐停药，以防反跳。(3) 对胰腺手术并发症的预防和治疗，手术开始时以每小时 250 μg 的速度静脉滴注，手术后持续用药 5 日。(4) 糖尿病酮症酸中毒的辅助治疗，以每小时 100 ~ 500 μg 的速度静脉滴注，同时配合胰岛素治疗。一般 3 小时内可缓解酮症酸中毒，4 小时内可使血糖恢复正常。(5) 急性胰腺炎的治疗，应尽早用药，每小时 250 μg 静脉滴注，连续用药 72 ~ 120 小时。

【制剂与规格】注射用生长抑素：① 250 μg；② 750 μg；③ 3 mg。

奥曲肽[保(乙)]

Octreotide

【适应证】(1) 缓解与功能性胃肠胰内分泌瘤有关的症状和体征。(2) 预防胰腺手术后并发症。(3) 与内镜硬化剂等特殊手段联合用于肝硬化所致的食管-胃静脉曲张出血的紧急治疗。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】(其他见 5.3.1)

【用法与用量】(1) 皮下注射：①用于预防胰腺手术后并发症，皮下注射一次 0.1 mg，一日 3 次，连续 7 日，第一次用药至少在术前 1 小时进行。②用于胃肠胰内分泌肿瘤，皮下注射，一次 50 μg，一日 1 ~ 2 次，渐增至一次 0.2 mg，一日 3 次，用药不能超过 7 日。③用于肢端肥大症，皮下注射，一次 0.05 ~ 0.1 mg，每 8 小时 1 次，多数患者一日最适剂量为 0.2 ~ 0.3 mg，一日最大剂量不宜超过 1.5 mg，在监测血浆 GH 水平的指导下治疗数月后可酌情减量。本品治疗 1 个月后，若 GH 浓度无下降，临床症状无改善，则应考虑停药。(2) 静脉滴注：用于食管静脉曲张出血，连续静脉滴注，每小时 25 μg，最多治疗 5 日。

【制剂与规格】奥曲肽注射液：① 1 ml : 0.05 mg；② 1 ml : 0.1 mg。

乌司他丁[保(乙)]

Ulinastatin

【适应证】用于急性胰腺炎，慢性复发性胰腺炎，急性循环衰竭的抢救辅助用药。

【注意事项】(1) 有药物过敏史、对食品过敏者或过敏体质患者慎用。(2) 本品用于急性循环衰竭时，应注意不能代替一般的休克疗法（输液法、吸氧、外科处理、抗生素），休克症状改善后即中止给药。(3) 本品溶解后应迅速使用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 血液系统：偶见白细胞减少或嗜酸粒细胞计数增多。(2) 消化系统：偶见恶心、呕吐、腹泻、AST 及 ALT 升高。(3)注射部位：偶见血管痛、发红、瘙痒、皮疹等。(4) 偶见过敏，出

现过敏症状应即停药并适当处理。

【用法与用量】静脉注射或滴注：(1) 用于急性胰腺炎、慢性复发性胰腺炎，初期一次 10 万 U，溶于 5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液 500 ml 中滴注，一次 1 ～ 2 小时，一日 1 ～ 3 次，以后随症状消退而减量。(2) 用于急性循环衰竭，一次 10 万 U 溶于 5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液 500ml 中静脉滴注，一次 1 ～ 2 小时，一日 1 ～ 3 次；或一次 10 万 U 溶于氯化钠注射液 2ml 中，缓慢静脉注射，一日 1～3 次，并可根据年龄、症状适当增减。

【制剂与规格】注射用乌司他丁：① 2.5 万 U；② 5 万 U；③ 10 万 U。

3.12 急性胆囊炎及其药物治疗

急性胆囊炎 (acute cholecystitis) 系因化学性刺激或细菌感染引起的胆囊急性炎症，临床表现为右上腹疼痛伴恶心、呕吐、轻度黄疸、发热和白细胞增多等，是常见外科急腹症之一，也是胆囊结石常见的并发症。

药物治疗包括：①解痉镇痛对症治疗。有阵发性腹痛者，可予以山莨菪碱（见 3.1.4.1）或阿托品（见 3.1.4.1）肌内注射。诊断明确而腹痛剧烈者必要时可用哌替啶（见 17.4.2）肌内注射。吗啡可使胆道平滑肌张力增加，故不宜使用。可用 33%硫酸镁（见 3.9.2）溶液口服或胃管注入利胆治疗。②抗生素应用。急性胆囊炎应及时控制感染，改善症状。胆系感染的细菌可能为大肠埃希菌、肠球杆菌、肺炎杆菌、其他革兰阴性杆菌和厌氧菌。宜选用在胆汁中浓度高的药物，一般可用第二、三代头孢菌素、第三代喹诺酮及抗厌氧菌药物。③口服溶石治疗。各种口服溶石药物，如鹅去氧胆酸、熊去氧胆酸等，均是通过降低胆固醇饱和度起到溶石作用，故仅对胆固醇结石有效。

去氢胆酸 [保(乙)]

Dehydrocholic Acid

【适应证】本品有利胆作用，可促进胆汁分泌，增加胆汁容量，促使胆道畅通，对消化脂肪也有一定的促进作用。

【注意事项】(1) 本品为辅助治疗药，第一次使用本品前应咨询医师。治疗期间应定期到医院检查。(2) 妊娠初始 3 个月的妇女慎用。(3) 儿童不宜使用。(4) 过敏体质者慎用。

【禁忌证】重症肝炎、充血性心力衰竭、原因不明的直肠出血、胆道完全阻塞及严重肝肾功能减退患者、对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 可见嗳气、打嗝、腹泻、恶心、肌痉挛、直肠区周围皮肤刺激等，如持续存在，应对症处理。(2) 长期服用或用量过多，可致电解质紊乱，甚至出现呼吸困难、心搏骤停、心律失常、肌痉挛、极度疲乏、无力等。

【用法用量】口服：成人一次 0.25 ～ 0.5 g，一日 3 次，餐后服用。

【制剂与规格】去氢胆酸片：0.25 g。

熊去氧胆酸 [基(基)，保(甲)]

Ursodeoxycholic Acid

【适应证】用于胆固醇型胆结石及胆汁缺乏性脂肪泻，也可用于预防药物性结石形成及治疗脂肪痢（回肠切除术后）。

【注意事项】(1) 长期使用本品可增加外周血小板的数量。(2) 如治疗胆固醇结石中出现反复胆绞痛发作，症状无改善甚至加重，或出现明显结石钙化时，则宜中止治疗，并进行外科手术。(3) 本品不能溶解胆色素结石、混合结石及不透 X 线的结石。

【禁忌证】(1) 严重肝功能减退者禁用。(2) 胆道完全梗阻、急性胆囊炎、胆管炎。(3) 妊娠及哺乳期妇女。(4) 胆结石钙化病人，出现胆管痉挛或胆绞痛时。

【不良反应】常见腹泻；偶见便秘、过敏、头痛、头晕、胰腺炎和心动过速等。

【用法与用量】口服：成人按体重一日 8～10 mg/kg，早、晚进餐时分次给予。疗程最短为 6 个月，6 个月后超声波检查及胆囊造影无改善者可停药；如结石已有部分溶解则继续服药直至结石完全溶解。

【制剂与规格】熊去氧胆酸片：① 50 mg；② 150 mg；③ 250 mg。

熊去氧胆酸胶囊：① 50 mg；② 150mg；③ 250 mg。

茴三硫[保(乙)]

Anethole Trithione

【适应证】用于胆囊炎、胆结石及消化不良及急、慢性肝炎的辅助治疗。

【注意事项】(1) 甲状腺功能亢进者慎用。(2) 服药期间，尿液可呈黄色。(3) 如持续出现软便，可将剂量由一日3次改为一日2次（早、晚各25 mg）。

【禁忌证】对本品过敏者；胆道完全梗阻者。

【不良反应】偶有发生荨麻疹样红斑、软便。

【用法与用量】口服：一次25 mg，一日3次，或遵医嘱。

【制剂与规格】茴三硫片：25 mg。

苯丙醇[保(乙)]

Phenylpropanol

【适应证】用于慢性胆囊炎的辅助治疗。

【注意事项】(1) 如应用本品超过3周，一日剂量不宜超过0.2 g。(2) 妊娠初始3个月的妇女慎用。(3) 儿童用量请咨询医师或药师。(4) 如服用过量或出现严重不良反应，请立即就医。(5) 当药品性状发生改变时禁止服用。

【禁忌证】对本品过敏者、胆道阻塞性黄疸患者禁用。

【不良反应】偶见胃部不适，减量或停药后消失。

【用法与用量】口服：成人一次0.1 g，一日3次。

【制剂与规格】苯丙醇胶丸：0.1 g。

曲匹布通[保(乙)]

Trepibutone

【适应证】用于胆石症、胆囊炎、胆道运动障碍、胆囊术后综合征及慢性胰腺炎。

【注意事项】完全性胆道梗阻、急性胰腺炎患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠期妇女、严重肝肾功能不全者禁用。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、食欲缺乏、涎液分泌过多、胃部不适、腹胀、腹泻、便秘、皮疹、瘙痒、眩晕、头痛和倦怠等。

【用法与用量】口服：一次40 mg，一日3次，餐后服用，疗程2～4周。

【制剂与规格】曲匹布通片：40 mg。

3.13 肝硬化与门静脉高压症用药

3.13.1 肝硬化的药物治疗

肝硬化（hepatic cirrhosis）是一种常见的由不同病因引起的肝脏的慢性、进行性、弥漫性病变。肝硬化的治疗是综合性的。首先针对病因进行治疗，如酒精性肝硬化患者必须戒酒；乙型肝炎病毒复制活跃伴肝纤维化患者可行抗病毒治疗，忌用对肝脏有损害的药物。晚期主要针对并发症治疗。目前尚无肯定有效的逆转肝硬化的药物，部分临床试验结果提示活血化淤软坚的中药用于早期肝硬化的抗纤维化治疗有一定疗效。

3.13.2 门静脉高压症（包括胃底食管静脉曲张破裂出血）的药物治疗

门静脉高压症（portal hypertension）的发生机制主要和门静脉系统的血流增多及门静脉系统阻力增高有关。因此从理论上说能够减少门静脉系统血流量或降低门静脉系统阻力的药物均有可能降低门静脉高压。前者主要包括非选择性β受体拮抗药（普萘洛尔、纳多洛尔），后者主要包括有机硝酸盐类（硝酸异山梨酯、单硝酸异山梨酯），钙通道阻滞药（硝苯地平），α_1受体拮抗药（哌唑嗪），肾素-血管紧张素系统阻断药（血管紧张素转换酶抑制药及血管紧张素Ⅱ受体拮抗药）。目前经严格临床研究证明有效的药物包括非选择性β受体拮抗药（阻断心脏β_1受体以降低心排血量、阻断β_2受体从而使内脏血管收缩而减少门静脉血流，降低门静脉压力）和有机硝酸盐类（通过产生一氧化氮而降低细胞内钙离子浓度，扩张静脉系统、降低门静脉系统的阻力，从而降低门静脉压力）。

临床上药物治疗门静脉高压的目的：①预防胃底食管静脉曲张的发生；②预防首次胃底食管静脉曲张破裂出血；③治疗

急性胃底食管静脉曲张破裂出血；④预防再次胃底食管静脉曲张破裂出血。

目前不推荐应用药物预防胃底食管静脉曲张的发生。对于仅有轻度的胃底食管静脉曲张的患者也不主张用药物预防首次出血。因为对这种疗效尚不肯定。

对于已经出现中到重度胃底食管静脉曲张的患者应当给予药物治疗，以预防首次出血。一般首选非选择性 β 受体拮抗药，如普萘洛尔，从小剂量开始增至使基础心率降低 25%（但不得低于 55 次／分钟），或达到最大耐受量。服用 2 年可使首次出血发生率由 25% ~ 30% 降低到 15% ~ 22%，但对病死率改善不明显。如果不能耐受本品，有本类药物的禁忌证或效果不好，可试用 5- 单硝酸异山梨醇。两者联合应用效果并不显著增加，但不良反应增加，因而不推荐使用。

对于急性胃底食管静脉曲张破裂出血者，应立即给予药物治疗。①加压素（见 5.3.3）+ 硝酸甘油（见 4.8.2）：垂体后叶素主要通过收缩内脏血管，减少门静脉血流量，达到曲张静脉止血。不主张给予初剂负荷量。此药的不良反应有腹痛、血压升高、心绞痛等，有心血管疾病者禁用。应合并使用硝酸甘油。加压素的临时止血效果尚满意，但必须静脉内持续均匀地给药，停药后多数患者又发生再出血，因此只能用于急性大出血时的临时措施，为其他治疗创造条件。②加压素类似药：其优点有耐受性好，不良反应小，不需静脉持续输注及作用时间长等。如特利加压素为长效加压素，可显著降低门静脉压力和胃底食管曲张静脉内压力，几乎无加压素的心、脑血管不良反应，但价格昂贵。③生长抑素及其类似物：生长抑素是一种胃肠激素，能抑制胰高血糖素和其他胃肠道激素的分泌，减少内脏血流量和降低门静脉压力，而对全身血流动力学影响较小。人工合成的生长抑素（14 肽）和 8 肽奥曲肽，半衰期较长，持续静脉滴注，连续 36 ~ 48 小时，出血停止后逐渐减量。

对于已经发生首次胃底食管静脉曲张破裂出血的患者，均应给予治疗以预防再次出血，首选非选择性 β 受体拮抗药治疗，它可使再出血率由 63% 降低到 42%。如果不能使肝静脉压力梯度降至 12 mmHg 以下，或比基础值降低 >20%，可加用 5- 单硝异山梨酯。如果单用药物治疗失败，可联合应用非选择性 β 受体拮抗药及内镜疗法（硬化疗法或结扎法）。

第3章 消化系统疾病用药

特利加压素

Terlipressin

【适应证】用于食管、胃肠道等消化道疾病引起的急性大出血的辅助治疗。

【注意事项】(1) 高血压、晚期动脉粥样硬化、心律失常或冠脉功能不全者慎用。(2) 应监测血压、血清电解质及液体平衡。

【禁忌证】(1) 患有冠心病、高血压、脑血管病、周围血管病、机械性肠梗阻、肾衰竭者。(2) 妊娠期妇女。(3) 对本品过敏者。

【不良反应】可见腹绞痛、排便次数增加、头痛、面色发白、血压升高或降低、冠状动脉痉挛、心绞痛、诱发心肌梗死、心力衰竭、脑血管意外、少尿和尿失禁。

【用法与用量】静脉注射：治疗食管胃底静脉曲张出血，首剂 2 mg（用氯化钠注射液稀释）静脉缓慢注射（超过 1 分钟），维持剂量为每 4 小时静脉缓慢注射 1 ~ 2 mg 延续 24 ~ 48 小时，直至出血控制。建议出血停止后仍维持治疗 1 ~ 2 日，以防止再出血。用于其他胃肠道出血，对疑为上消化道出血的患者进行早期治疗时使用，可每 4 ~ 6 小时缓慢静脉注射 1 mg，连续用药，直至出血控制。本品也可作为急救药物使用。

【制剂与规格】注射用特利加压素：1 mg。

垂体后叶素[保（甲）]

Pituitrin

【适应证】(1) 因宫缩不良所致的产后出血、产后子宫复旧不全。(2) 肺出血、食管及胃底静脉出血。(3) 尿崩症。

【注意事项】(1) 有剖宫产史者慎用（可发生胎儿窒息或子宫破裂）。(2) 静脉注射速度过快可引起腹痛或腹泻，应注意控制药物浓度和滴速。(3) 本品对子宫颈有较强的兴奋作用，不宜用于引

产或催产，在胎儿分娩前严禁静脉注射。(4) 用于产后子宫出血时，应在胎盘娩出后给药。(5) 药液稀释后宜置于冷处储存，并避免冻结。

【禁忌证】妊娠高血压症、高血压、心力衰竭、冠状动脉病、肺源性心脏病者禁用。骨盆过于狭窄、胎位不正、产道阻碍者禁用。由动物神经垂体中提取的制品中含有微量的异性蛋白而易致过敏，对有过敏反应史者禁用。

【不良反应】常见血压升高、尿量减少、尿急、心悸、胸闷、心绞痛、出汗、面色苍白、恶心、呕吐、腹痛；偶见有血管神经性水肿、支气管哮喘、荨麻疹、过敏性休克，应立即停药并对症处理。

【用法与用量】(1) 肌内注射：用于产后出血或子宫复旧，一次 5 ~ 10 U；用于产后止血，须在胎儿或胎盘均已分娩出后再次注射 10 U，如作预防性应用，可在胎儿前肩娩出后立即静脉注射 10 U。(2) 静脉注射或静脉滴注：用于临产子宫收缩无力或阵缩弛缓，一次 5 ~ 10 U，但需慎重；用于产后止血，一次 5 ~ 10 U，极量 20 U；用于肺出血，一次 10 ~ 20 U。

【制剂与规格】垂体后叶素注射液：① 1 ml：5 U；② 1 ml：10 U。

3.13.3 保护肝脏与降低肝酶药

保护肝脏药通称保肝药，包括抗肝脏坏死药、促肝脏细胞修复药和降低肝氨基转移酶药，一般作为各种肝炎、肝硬化的辅助治疗。保肝药的主要作用包括：①可能改善肝脏功能，保护由多种化学物质和毒素所引起的肝损伤；②促进肝细胞再生、减轻肝细胞变性；③增强肝脏解毒能力；④降低肝酶 AST 及 ALT，但其确切疗效需经大样本的循证医学研究所证实，其中有些药品的效果尚待评价。

应用保肝药应配合抗病毒药（清除肝炎病毒的数量）、免疫调节药（增加人体免疫功能）、营养药和调节血脂药（降低血脂、促进糖和脂肪代谢）同时治疗。常用药物有葡醛内酯、硫普罗宁、齐墩果酸、联苯双酯、水飞蓟素、谷胱甘肽等。

葡醛内酯（Glucurolactone），可能增加肝糖原、减少脂肪在肝内沉积；同时，其以葡萄糖醛酸形式与胆红素、代谢废物、药物或毒素结合后从胆汁排泄，具有解毒作用。口服：成人一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 3 次；5 岁以下儿童一次 50 mg，5 岁以上一次 100 mg，一日 3 次。

谷胱甘肽（Glutathione），分为还原型(G-SH)和氧化型(G-S-S-G)两种形式，在生理条件下以还原型谷胱甘肽占绝大多数。谷胱甘肽做为体内一种重要的抗氧化剂，能清除体内的自由基，清洁和净化人体内环境。由于还原型谷胱甘肽本身易受某些物质氧化，所以在体内能够保护许多蛋白质和酶分子中的巯基不被如自由基等有害物质氧化，从而让蛋白质和酶等分子发挥其生理功能。谷胱甘肽尚可保护红细胞膜上蛋白质的巯基处于还原状态，防止溶血，且可保护血红蛋白不受过氧化氢、自由基等氧化，从而使它持续正常地发挥运输氧的能力。

谷胱甘肽用于螯合重金属、氟化物、芥子气等毒素中毒外，尚在肝炎、溶血性疾病及角膜炎、白内障和视网膜疾病等，作为辅助治疗药。肌内注射或静脉注射：一次 50 ~ 100 mg，一日 1 ~ 2 次。

目前，保肝药虽品种很多，但尚无特效药。且大多数保肝药在肝内需经生物转化而排出体外。如应用过多，会增加肝脏负担，使肝功能损害进一步加重。所以保肝药不可滥用。

联苯双酯 [基(基)，保(甲)]

Bifendate

【适应证】用于迁延性肝炎的主要症状如肝区痛、乏力、腹胀等改善及长期单项 ALT 异常者。

【注意事项】(1) 慢性活动性肝炎患者慎用。(2) 少数患者在用药过程中 ALT 可回升，加大剂量可使之降低。停药后部分患者 ALT 反跳，但继续服药仍有效。若与肌苷联合应用可减少降酶反跳现象。(3) 个别患者于服药过程中可出现黄疸及病情恶化，应及时停药。用药过程中若出现皮疹，一般加用抗组胺药后即可消失。(4) 应用本品治疗需要持续 2 ~ 3 个月，待血清 ALT 降至正常并平稳后逐渐停药，不宜突然停药，以防血清 ALT 反跳。

(5) 本品可改善迁延性肝炎患者的症状但对肝大、脾大的改变无效。

【禁忌证】肝硬化者禁用。

【不良反应】偶见轻度恶心、口干、胃部不适、皮疹等，但不影响治疗；另可见病毒性肝炎患者服用后出现黄疸、肝功能损害和症状加重，但停药后症状迅速消失，肝功能恢复正常。

【用法与用量】口服：一次 25 ~ 50 mg，一日 3 次，一日量 75 ~ 150 mg。

【制剂与规格】联苯双酯片：① 25 mg；② 50 mg。

联苯双酯滴丸：25 mg。

还原型谷胱甘肽 [保(乙)]

Reduced Glutathione

【适应证】片剂用于慢性乙肝的保肝治疗。注射剂用于：①化疗患者：包括应用顺铂、环磷酰胺、多柔比星、柔红霉素、博来霉素化疗者，尤其是大剂量化疗时。②放射治疗患者。③各种低氧血症：如急性贫血，成人呼吸窘迫综合征，败血症等。④肝脏疾病：包括病毒性、药物毒性、酒精毒性（包括酒精性脂肪肝、酒精性肝纤维化、酒精性肝硬化、急性酒精性肝炎）及其他化学物质毒性引起的肝脏损害。⑤亦可用于有机磷、胺基或硝基化合物中毒的辅助治疗。⑥解除药物毒性（如肿瘤化疗药、抗结核药、精神与神经科药、抗抑郁药、对乙酰氨基酚等）。

【注意事项】(1) 本品应在医生监护下，在医院内使用。(2) 注射前必须完全溶解，外观澄清、无色。(3) 放在儿童不易触及的地方。(4) 如在用药过程中有出疹、面色苍白、血压下降、脉搏异常等症状，应即停药。(5) 肌内注射仅限于需要此途径给药时使用，并应避免同一部位反复注射。(6) 新生儿、早产儿、婴儿和儿童慎用，尤其是肌内注射。老年患者应适当减量，并在用药过程中严密监护。

【不良反应】偶见面色苍白、血压下降，脉搏异常等类过敏症状，应及时停药。偶见皮疹等过敏症状，应停药。偶有食欲减退、恶心、呕吐、胃痛等症状，停药后可消失。注射局部有轻度疼痛。

【禁忌证】对本品有过敏反应者禁用。

【用法与用量】口服：一次 400 mg，一日 3 次，疗程 12 周。

(1) 用法：①静脉滴注：溶解于注射用水后，加入氯化钠或 5% 葡萄糖注射液 100 ~ 500 ml 中静脉滴注。②肌内注射：溶于注射用水后肌内注射。

(2) 用量：①化疗患者，在给化疗药前 15 分钟内将 1.5 g/m^2 本品溶解于氯化钠注射液 100 ml 中，于 15 分钟内静脉滴注，第 2 ~ 5 日每日肌内注射本品 0.6 g。使用环磷酰胺时，为预防泌尿系统损害，建议在环磷酰胺注射完后立即静脉注射本品，于 15 分钟内输注完毕；用顺氯铵铂化疗时，建议本品的用量不宜超过 35 mg/mg 顺铂，以免影响化疗效果。②肝脏疾病的辅助治疗，用于病毒性肝炎，静脉滴注一次 1.2 g，一日 1 次，连续 30 日；重症肝炎，静脉滴注一次 1.2 ~ 2.4 g，一日 1 次，连续 30 日；用于活动性肝硬化，静脉滴注一次 1.2 g，一日 1 次，连续 30 日；用于脂肪肝，静脉滴注一次 1.8 g，一日 1 次，连续 30 日；用于酒精性肝炎，静脉滴注，一次 1.8 g，一日 1 次，14 ~ 30 日；药物性肝炎，静脉滴注一次 1.2 ~ 1.8 g，一日 1 次，连续 14 ~ 30 日；静脉滴注时间为 1 ~ 2 小时。③用于放疗辅助用药，于照射后给药，剂量 1.5 g/m^2，或遵医嘱。④其他疾病，如低氧血症，可将 1.5 g/m^2 本品溶于氯化钠注射液 100 ml 中静脉滴注，病情好转后一日 0.3 ~ 0.6 g 肌内注射维持。肝脏疾病一般 30 日为 1 个疗程，其他情况根据病情决定。

【制剂与规格】还原型谷胱甘肽薄膜衣片：0.1 g。

注射用还原型谷胱甘肽：0.6 g。

α-硫辛酸 [保(乙)]

α-Lipoic Acid

【适应证】用于治疗糖尿病周围神经病变引起的感觉异常。

【注意事项】配好的输液用铝箔包裹避光，6 小时内可保持稳定。本品不能与葡萄糖溶液、格林溶液及所有可能与硫基或二硫键起反应的溶液配伍使用。在治疗糖尿病神经周围病变的同时，对糖尿病本

身的控制也是必需的。由于活性成分对光敏感，因此应在使用前才将安瓿从盒内取出。静脉注射应缓慢，最大速度为每分钟 50 mg。

【禁忌证】已知对 α-硫辛酸过敏者。妊娠及哺乳期妇女不应使用本品。本品注射液含苯甲醇，因此不能用于新生儿，尤其是早产儿。

【不良反应】静脉滴注过快偶可出现头胀和呼吸困难，但可自行缓解，极个别患者使用本品后，出现抽搐、复视、紫癜以及由于血小板功能异常引起的出血倾向。肌内注射偶可在注射部位出现局部变态反应，表现为荨麻疹或湿疹，也可能出现全身变态反应，严重者可发生休克。若发生休克，医护人员应及时抢救。有极个别本品中的苯甲醇过敏的病例报道。

【用法与用量】静脉注射或肌内注射：用于肌内注射，每个注射部位不得超过 50 mg。如需大剂量给药，可按每个注射部位最大注射量 2 ml，分数个不同部位给药。本品也可加入氯化钠注射液静脉滴注，如 250 ~ 500 mg 加入 100 ~ 250 ml 氯化钠注射液中，静脉滴注 30 分钟。除非有特别医嘱，对严重的糖尿病周围神经病变引起的感觉异常患者，可静脉注射，一日 300 ~ 600 mg，2 ~ 4 周为 1 个疗程。维持治疗可口服给药，一日 200 ~ 300 mg，分 2 ~ 3 次服用。

【制剂与规格】α-硫辛酸片：(1) 200 mg；(2) 300 mg；(3) 600 mg。

α-硫辛酸注射液：(1) 6 ml : 150 mg；(2) 12 ml : 300 mg；(3) 20 ml : 600 mg。

促肝细胞生长素 [保（乙）]

Hepatocyte Growth-promoting Factors

【适应证】用于各种重型病毒性肝炎（急性、亚急性、慢性重症肝炎的早期或中期）的辅助治疗。

【注意事项】(1) 本品使用应以针对重型肝炎的综合治疗为基础。(2) 对过敏体质者慎用。(3) 本品溶解后为淡黄色透明液体，如有沉淀、混浊时禁用；冻干制品已变棕黄色时忌用。(4) 肌内注射用的制剂不能用于静脉滴注。(5) 用药前后及用药期间应监测肝功能，用药期间注意观察甲胎蛋白（AFP）。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】可见过敏、皮疹和低热，停药后即可消失；注射部位偶见疼痛和皮肤潮红。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：一次 80 ~ 100 mg 加入 10% 葡萄糖注射液 250 ml 缓慢滴注，一日 1 次，疗程视病情而定，一般为 4 ~ 6 周，慢性重型肝炎，疗程为 8 ~ 12 周。(2) 肌内注射：一次 40 mg，用氯化钠注射液稀释后注射，一日 2 次。

【制剂与规格】注射用促肝细胞生长素：① 20 mg；② 60 mg。

多烯磷脂酰胆碱 [保（乙）]

Polyene Phosphatidylcholine

【适应证】用于急性和慢性肝病、预防胆结石复发、怀孕导致的肝脏损害（妊娠中毒）、银屑病、放射综合征。

【注意事项】儿童用量酌减，或遵医嘱。

【禁忌证】对本药所含的任何一种成分过敏者禁用。

【不良反应】在大剂量时偶见胃肠道紊乱（腹泻）。

【用法与用量】口服：起始一次 456 mg，一日 3 次，一日最大量不能超过 1 368 mg。一段时间后，剂量可减至一次 228 mg，一日 3 次维持，于餐中或餐后用足够量的液体整粒吞服，不要咀嚼。

【制剂与规格】多烯磷脂酰胆碱胶囊：228 mg。

甘草酸二铵 [保（乙）]

Diammonium Glycyrrhizinate

【适应证】用于伴有丙氨酸氨基转移酶（ALT）升高的急、慢性病毒性肝炎。

【注意事项】(1) 治疗过程中应定期检测血压、血清钾、钠浓度，如出现高血压、血钠潴留、低血钾等情况，应停药或适当减量。(2) 妊娠及哺乳期妇女不宜使用。

【禁忌证】严重低钾血症、高钠血症、高血压、心力衰竭、肾衰竭患者禁用。

【不良反应】①消化系统：可出现食欲减退、恶心、呕吐、腹胀。②心脑血管

系统：可出现头痛、头晕、胸闷、心悸及血压升高。③其他：瘙痒、荨麻疹、口干和水肿。以上症状一般较轻，不影响治疗。

【用法与用量】口服：成人一次150 mg，一日3次。

【制剂与规格】甘草酸二铵胶囊：50 mg。

硫普罗宁[保(乙)]

Tiopronin

【适应证】用于改善急、慢性乙型肝炎患者的肝功能。

【注意事项】服用本品期间应注意全面观察患者状况，定期监测肝功能，如发现异常应停服本品，或相应处治。

【禁忌证】对本品过敏患者禁用。

【不良反应】(1) 消化系统：偶见食欲减退、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等症状，罕见味觉异常，可减量或暂时停服。(2) 过敏反应：偶见瘙痒、皮疹、皮肤发红等，应停服本品。(3) 长期、大量服用罕见蛋白尿或肾病综合征，应减量或停服。(4) 其他：罕见胰岛素性自体免疫综合征、疲乏和肢体麻木，应即停服。

【用法与用量】口服：一次100～200 mg，一日3次，疗程2～3个月或遵医嘱。急性病毒性肝炎患者，一次200～400 mg，一日3次，连续1～3周，于餐后服用。

【制剂与规格】硫普罗宁片：0.1 g。

葡醛内酯[保(乙)]

Glucurolactone

【适应证】用于急慢性肝炎的辅助治疗。

【注意事项】如服用过量或出现严重不良反应，请即就医。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见面部潮红、轻度胃肠不适，减量或停药后即可消失。

【用法与用量】口服：成人一次100～200 mg，5岁以下儿童一次50 mg，5岁以上儿童一次100 mg，一日3次。

【制剂与规格】葡醛内酯片：①50 mg；② 100 mg。

双环醇[保(乙)]

Bicyclol

【适应证】用于治疗慢性乙型和慢性丙型肝炎。

【注意事项】(1) 用药期间应密切观察患者临床症状、体征和肝功能变化，疗程结束后也应加强随访。(2) 目前尚无14岁以下患者的疗效和安全性资料。(3) 有肝功能失代偿如胆红素明显升高，低白蛋白血症，肝硬化腹水，食管静脉曲张出血，肝性脑病及严重心、脑、肾器质性病变及骨髓抑制的患者，谨遵医嘱。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】罕见皮疹发生，皮疹明显者可停药观察，必要时可服用抗过敏药。

【用法与用量】口服：成人常用量一次25 mg，必要时可增至50 mg，一日3次，最少服6个月或遵医嘱。

【制剂与规格】双环醇片：25 mg。

水飞蓟宾[保(乙)]

Silibinin

【适应证】用于急慢性肝炎、脂肪肝的肝功能异常的恢复。

【注意事项】妊娠及哺乳期妇女、老年人、儿童慎用。用于治疗脂肪肝、肝硬化时，最好不过多食用高脂食物。用于长期酗酒、吸烟的肝损害治疗时，可采用维持疗法。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见轻微的胃肠道症状，如恶心、呃逆和胸闷等。

【用法与用量】口服：成人一次70～140 mg，一日3次，餐后服用，维持剂量可减半，一日3次。

【制剂与规格】水飞蓟宾片：① 35mg；② 70 mg。

水飞蓟宾胶囊：① 35 mg；② 140 mg。

异甘草酸镁[保(乙)]

Magnesium Isoglycyrrhizinate

【适应证】用于慢性病毒性肝炎，改善肝功能异常。

【注意事项】(1) 治疗过程中，应定期测血压和血清钾、钠浓度。(2) 本品可能引起假性醛固酮症增多，在治疗过程中

如出现发热、皮疹、高血压、血钠潴留、低钾血症等情况，应即停药。(3) 妊娠及哺乳期妇女、新生儿、婴幼儿慎用；目前尚未有老年患者的用药经验，应注意观察患者的病情，慎重用药。

【禁忌证】严重低钾血症、高钠血症、高血压、心力衰竭、肾衰竭患者禁用。

【不良反应】可见低钾血症、心悸、眼睑水肿、头晕、皮疹、呕吐。

【用法与用量】静脉滴注：一次 0.1 g，一日 1 次，以 10% 葡萄糖注射液 250 ml 稀释后滴注，4 周为 1 个疗程或遵医嘱，如病情需要，一日可用至 0.2 g。

【制剂与规格】异甘草酸镁注射液：10 ml ∶ 50 mg（以异甘草酸镁计）。

苦参素 [保（乙）]

Marine

【适应证】用于慢性乙型病毒性肝炎的治疗及肿瘤放疗、化疗引起的白细胞低下和其他原因引起的白细胞减少症。

【注意事项】(1) 请在医师指导下使用本品。(2) 严重肝功能不全者慎用，长期使用应密切注意肝功能变化。(3) 严重肾功能不全者，不建议使用本品。(4) 用药后出现药疹者应停药。(5) 妊娠妇女不宜使用，哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者禁用。(2) 有严重血液、心、肝、肾及内分泌疾病者禁用。

【不良反应】肌内注射时，个别患者注射后出现局部疼痛，改为深部注射后可减轻。常见的不良反应有头晕、恶心、呕吐、口苦、腹泻、上腹不适或疼痛，偶见皮疹、胸闷、发热，症状一般可自行缓解。

【用法与用量】肌内注射：临用前先用注射水溶解一次 0.4 ~ 0.6 g，一日 1 次；用于升高白细胞一次 0.2 g，一日 2 次。

【制剂与规格】注射用苦参素：0.2 g。

复方甘草酸苷注射液 [保（乙）]

Compound Glycyrrhizin Injection

【适应证】治疗慢性肝病，改善肝功能异常。也可用于治疗湿疹、皮炎、荨麻疹。

【注意事项】(1) 高龄患者慎用。(2) 与含甘草的制剂并用时，由于本品亦为甘草酸苷制剂，容易出现假性醛固酮增多症，应予注意。(3) 静脉内给药时，应注意观察患者的状态，尽量缓慢速度给药。

【禁忌证】(1) 对本品既往有过敏史患者。(2) 醛固酮症患者、肌病患者、低钾血症患者（可加重低钾血症和高血压症）。

【不良反应】(1) 本品可有血钾降低、心悸、血压上升、上腹不适、皮肤瘙痒、荨麻疹、口干和水肿、头痛、头晕等。(2) 有报道口服本品，可出现横纹肌溶解症。(3) 有时可能出现休克、过敏性休克、假性醛固酮症、肌肉痛、感觉异常、发热、换气过度、尿糖阳性等。

【用法与用量】静脉注射：成人通常一次 5 ~ 20 ml，一日 1 次。可依年龄、症状适当增减。慢性肝病一次 40 ~ 60 ml，一日 1 次，静脉注射或静脉点滴。可依年龄、症状适当增减，增量时用量限度为一日 100 ml。

【制剂与规格】复方甘草酸苷注射液：20 ml ∶ 甘草甜素 40 mg、甘草酸单铵盐 53 mg、甘氨酸 400 mg、盐酸半胱氨酸 20 mg，作为添加物含有亚硫酸钠 16 mg 和适量氨水。

3.13.4 腹水的药物治疗

腹水患者的治疗主要是减少腹水以及预防复发。经限钠和卧床休息仍不消退者须应用利尿药。首选醛固酮拮抗药螺内酯，可以合用襻利尿药呋塞米，利尿药的使用应从小剂量开始，服药后体重下降为有效（无水肿者每天减轻体重 500 g，有下肢水肿者体重减轻一日 1 000 g）。如出现肝性脑病、低钠血症（血钠 <120 mmol/L），肌酐 >120 mmol/L 应停用利尿药。对于低蛋白血症患者，每周定期输注白蛋白、血浆可提高血浆胶体渗透压，促进腹水消退。对于难治性腹水还可用药物治疗，如输注白蛋白。

3.13.5 肝硬化并发症的药物治疗

3.13.5.1 自发性细菌性腹膜炎的药物治疗

对于临床上怀疑自发性细菌性腹膜炎（spontaneous bacterial peritonitis,

SBP），或腹水中性粒细胞＞ 250×10^6/L，应立即行经验性治疗，抗生素首选头孢噻肟或头孢曲松，用药后 48 小时再行腹水检查，如中性粒细胞数减少一半，认为抗生素治疗有效，疗程 5 ~ 10 日。腹水蛋白＜ 10 g/L、已发生过一次 SBP 及食管静脉破裂出血者是复发性 SBP 的高危患者，应口服环丙沙星一日 400 mg，7 ~ 14 日进行预防。

3.13.5.2 肝肾综合征的药物治疗

肝肾综合征（hepatorenal syndrome，HRS）的治疗原则，是增加动脉有效血容量和降低门静脉压力，在积极改善肝功的前提下，采取以下措施，如早期预防和消除诱发肝肾衰竭的因素，避免使用损害肾功能的药物。药物治疗的目的是增加肾血流量。应用较多的是血管收缩剂加输注白蛋白。白蛋白 1 g/kg，24 小时后一日 20 ~ 40 g，持续 5 ~ 10 日，使血肌酐＜ 132.6 μmol/L。血管活性药物特利加压素（见 3.13.2）0.5 ~ 2 mg 静脉注射，每间隔 12 小时一次，有肯定效果。

3.13.5.3 肝性脑病的药物治疗

肝性脑病（hepatic encephalopathy，HE）是严重肝病引起的以代谢紊乱为基础的中枢神经系统功能失调综合征，主要表现可以从人格改变、扑翼样震颤到出现意识障碍、昏迷和死亡。治疗肝性脑病的目的为治疗基础肝病和促进意识恢复。早期治疗远比进入昏迷期效果更好。首先应纠正或去除诱因；合理饮食和营养。药物治疗：①口服不吸收双糖（乳果糖和乳糖醇），对各种急、慢性 HE 均有一定疗效，它可使 HE 患者症状和脑电图明显改善，对亚临床肝性脑病的患者也有显著疗效。②口服肠道不易吸收的抗生素，能有效抑制肠道产尿素酶的细菌，减少氨的生成。由于这些药物有潜在毒性和导致耐药菌株产生的危险，目前多不主张长期应用。③服用不产生尿素酶的有益菌（乳酸杆菌，肠球菌，双歧杆菌），可抑制产生尿素酶细菌的生长，并酸化肠道，对防止氨和有毒物质的吸收有一定作用。④氟马西尼（见 17.2.6）为 γ - 氨基丁酸 / 苯二氮䓬（GABA/BZ）复合受体拮抗药，可以使内源性 BZ 衍生物导致的神经传导抑制得到短期改善。氟马西尼可能对部分急性肝性脑病患者有利。

门冬氨酸鸟氨酸（鸟氨酸天门冬氨酸）[保(乙)]

L-Ornithine-*L*-Aspartate

【适应证】用于因急、慢性肝病（如各型肝炎、肝硬化、脂肪肝、肝炎后综合征）引发的血氨升高及治疗肝性脑病，如伴发或继发于肝脏解毒功能受损（如肝硬化）的潜在性或发作期肝性脑病，尤其适用于治疗肝性脑病早期或肝性脑病期的意识模糊状态。

【注意事项】(1) 儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 当使用大剂量的本品时，应监测患者血清和尿中的药物水平。如患者的肝功能已经完全受损，输液速度必须根据患者的个体情况来调整，以免引起恶心和呕吐。

【禁忌证】严重肾功能不全的患者（诊断标准是血清肌酐水平超过 3 mg/100 ml）禁用本品。

【不良反应】偶见恶心，少数病例出现呕吐。总体来说，上述症状都是一过性的，不需停止治疗。如减少药物剂量或减慢输液速度，上述不良反应就可消失。

【用法与用量】(1) 口服：成人常用量一次 5 g，一日 2 ~ 3 次，溶解在水中，餐前或餐后服用。(2) 静脉滴注：①用于急性肝炎，一日 5 ~ 10 g；②用于慢性肝炎或肝硬化，一日 10 ~ 20 g，病情严重可适当增加剂量，但一日不得超过 40 g；③肝性脑病早期可视病情轻重，最多使用不超过 40 g。

【制剂与规格】门冬氨酸鸟氨酸颗粒：5 g。

门冬氨酸鸟氨酸注射液：10 ml : 5 g。

谷氨酸钠 [保(甲)]

Sodium Glutamate

【适应证】用于血氨过多所致的肝性脑病及其他精神症状。

【注意事项】(1) 肾功能不全者慎用。(2) 儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女慎

用。(3) 用药期间应注意电解质平衡，可能时测血二氧化碳结合力及钾、钠、氯含量。(4) 用于肝性脑病时，与谷氨酸钾合用，两者比例一般为3∶1或2∶1，钾低时为1∶1。

【禁忌证】少尿、尿闭者禁用。

【不良反应】①大量谷氨酸钠治疗肝性脑病时，可导致严重的碱中毒与低钾血症，原因在于钠的吸收过多，因此在治疗过程中须严密监测电解质浓度。②输液太快，可出现流涎、面部潮红、呕吐等症状。③过敏的先兆可有面部潮红、头痛与胸闷等症状出现。④儿童可有震颤。⑤合并焦虑状态的患者用后可出现晕厥、心动过速及恶心等反应。

【用法与用量】静脉滴注：一次11.5 g，一日不超过23 g，用5%葡萄糖注射液稀释后缓慢滴注。

【制剂与规格】谷氨酸钠注射液：20 ml∶5.75 g。

谷氨酸钾[保(甲)]

Potassium Glutamate

【适应证】同谷氨酸钠。

【注意事项】(1) 肾功能不全慎用。(2) 儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女慎用。(3) 肾功能不全者或无尿患者慎用谷氨酸。(4) 不与谷氨酸钠合用时注意产生高钾血症。(5) 注射液每支谷氨酸钾含钾离子34 mmol，大剂量或高浓度使用可致心律失常。

【禁忌证】本品过量可致碱血症，故有碱血症者慎用或禁用。

【不良反应】①静脉滴注过快可引起流涎、皮肤潮红和呕吐。儿童可见震颤等。②大量谷氨酸钾治疗肝性脑病时，可导致高钾血症。静脉滴注期间应注意电解质平衡，可能时测血二氧化碳结合力及钾、钠、氯含量。③过敏先兆有面部潮红、头痛与胸闷等症状。④合并焦虑状态者可有昏厥、心动过速，流泪及恶心等。

【用法与用量】静脉滴注：用于治疗肝性脑病，将谷氨酸钾18.9 g溶于5%或10%葡萄糖注射液500～1 000 ml中缓慢滴注，一日1～2次，低钾血症患者适用。为维持电解质平衡，谷氨酸钾常与谷氨酸钠合用，以1∶3或1∶2混合应用。

【制剂与规格】谷氨酸钾注射液：20 ml∶6.3 g。

3.13.5.4 原发性胆汁性肝硬化的药物治疗

原发性胆汁性肝硬化(primary biliary cirrhosis，PBC)是多见于中年女性的慢性进行性胆汁淤积性肝脏疾病。临床有瘙痒、黄疸、肝大、骨质疏松等表现，绝大多数患者抗线粒体抗体阳性。病理特点为肝内进行性非化脓性小胆管破坏伴门脉区炎症、纤维化、最终可发展为肝硬化和肝衰竭。

对症支持治疗同肝硬化。特殊药物治疗包括熊去氧胆酸等。熊去氧胆酸能改善患者的临床和实验室指标及组织学损伤程度、延迟疾病发展。该药没有明显不良反应，但价格较昂贵并需长期治疗。对熊去氧胆酸单独治疗反应不完全的患者（定义为不能使肝酶降至正常和（或）发展为肝硬化）可考虑联合应用免疫抑制性药物，但联合用药的有效性还未被证实。

腺苷甲硫氨酸(腺苷蛋氨酸)[保(乙)]

Ademetionine

【适应证】用于肝硬化前和肝硬化所致肝内胆汁淤积，也用于妊娠期肝内胆汁淤积。

【注意事项】(1) 本品可用于妊娠期和哺乳期。(2) 儿童慎用。(3) 老年人用药尚未进行该项实验且无可靠参考文献。(4) 注射用冻干粉针须在临用前用所附溶剂溶解，溶解后保存＜6小时。静脉注射必须非常缓慢。(5) 稀释需使用等渗溶液，不可与碱性液体或含钙液体混合。(6) 配置时，请使用外径＜0.8 mm的针头，针头应扎进橡皮塞界定的圆形中央位置。(7) 口服片剂为肠溶片，最好整片吞服，不得嚼碎。(8) 建议在两餐之间服用。(9) 有血氨增高的肝硬化前及肝硬化患者必须在医生指导下服用本品，并注意血氨水平。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】因为本品只有在酸性环境中才能保持活性，故有些患者服后感烧

心和腹部坠胀；偶可引起昼夜节律紊乱，睡前服用催眠药可减轻此症状。以上症状均表现轻微，不需中断治疗。

【用法与用量】(1) 肌内或静脉注射：初始治疗，一日0.5～1g，连续2周。(2) 口服：维持治疗，一日1～2g。

【制剂与规格】腺苷甲硫氨酸肠溶片：0.5g。

注射用腺苷甲硫氨酸：0.5g。

第4章 心血管系统疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案
- 心力衰竭
- 心律失常
- 高血压
- 心绞痛
- 急性心肌梗死
- 血脂异常

4.1 心力衰竭用药

4.1.1 心力衰竭及其药物治疗

心力衰竭（heart failure）是一种复杂的临床症状群，主要临床表现为呼吸困难、乏力和液体潴留。心力衰竭起始于任何原因的初始心肌损伤（如心肌梗死、心肌病、炎症或血流动力学负荷过重等），后者引起心肌结构和功能的变化，并通过心肌重构而不断发展和加重，最后导致心室泵血和（或）充盈功能低下。

由于心脏受损的病因、部位、程度和功能等不尽相同，故可将心力衰竭分为急性和慢性心力衰竭；左心、右心及全心心力衰竭；收缩性、舒张性或混合型心力衰竭；低动力型和高动力型心力衰竭；前向性和后向性心力衰竭；以及有症状和无症状性心力衰竭等多种类型。其中以慢性收缩性心力衰竭最为常见。急性心力衰竭的治疗与慢性心力衰竭明显不同。

4.1.1.1 慢性心力衰竭

慢性心力衰竭可根据其发生发展的过程，从高发危险人群进展成器质性心脏病、出现心力衰竭症状直至难治性终末期心力衰竭。

慢性心力衰竭的治疗目标不仅是改善症状和提高生活质量，最重要的是防止和延缓心肌重构，从而降低心力衰竭的死亡率和住院率。慢性收缩性心力衰竭的常规治疗包括联合使用三大类药物，即利尿药、血管紧张素转换酶抑制药（ACEI）和β肾上腺素受体拮抗药（β受体拮抗药）。不能耐受ACEI者可用血管紧张素Ⅱ受体拮抗药（ARB）作为替代药。为进一步改善症状或控制心率等，地高辛是第四个联用的药物。醛固酮受体拮抗药可用于重度心力衰竭患者。

慢性舒张性心力衰竭的治疗目前还缺乏研究，主要措施是减轻症状和纠正导致左室舒张功能异常的基础疾病，包括积极控制高血压、冠状动脉血运重建、控制心房颤动的心室率或转复窦性心律。ACEI、ARB或β受体拮抗药有助于逆转左室肥厚或改善舒张功能，利尿药可缓解肺淤血和外周水肿。但地高辛有可能增加心肌耗氧量或损害心肌的松弛性，不推荐用于舒张性心力衰竭。除非伴快速心室率的心房颤动，用β受体拮抗药心室率仍不能满意控制的患者，需用地高辛。

（1）利尿药：利尿药是唯一能够充分控制心力衰竭患者液体潴留的药物，适用于所有曾有或现有液体潴留证据的心力衰竭患者。利尿药能迅速缓解症状，但缺乏改善长期预后的证据，因此不能作为单一治疗，而应与ACEI和β受体拮抗药联合应用。襻利尿药是大多数心力衰竭患者的首选药物，噻嗪类利尿药仅适用于有轻度液体潴留、伴有高血压而肾功能正常的患者。

（2）ACEI：ACEI是证实能显著降低心力衰竭患者死亡率的第一类药物，所有慢性收缩性心力衰竭患者，包括Ⅰ～Ⅳ级心功能的患者都需使用ACEI，而且需要终身使用，除非有禁忌证或不能耐受。

目前已有的证据表明，ACEI是治疗慢性收缩性心力衰竭的一线药物。应尽量选用在大规模随机临床试验中证实有效的制剂，如卡托普利、依那普利、赖诺普利、雷米普利、培哚普利、福辛普利等应终身维持使用。

（3）β受体拮抗药：临床试验显示，在应用ACEI和利尿药的基础上加用β受体拮抗药长期治疗，能改善临床情况和左室功能，并进一步降低总死亡率、降低心脏猝死率。因此，所有慢性收缩性心力衰竭、心功能Ⅰ～Ⅲ级的患者都必须使用β受体拮抗药，而且需终身使用，除非有禁忌证或不能耐受。心功能Ⅳ级患者需待病情稳定后，在严密监护下由专科医师指导使用。

β受体拮抗药用于慢性心力衰竭病情稳定者，一般应在利尿药和ACEI的基础上加用，选用临床试验证实有效的制剂，

如琥珀酸美托洛尔缓释片、比索洛尔或卡维地洛，也可使用酒石酸美托洛尔片。

(4) ARB：ARB 的作用机制与 ACEI 相近，目前主要用于因严重咳嗽而不能耐受 ACEI 的患者，替代 ACEI 作为一线治疗。坎地沙坦和缬沙坦是在临床试验中证实有效的两种。ARB 应用注意事项同 ACEI。应用中需重点监测低血压、肾功能异常、高钾血症等。

(5) 地高辛：地高辛是唯一经过安慰剂对照临床试验评价的洋地黄制剂，用于心力衰竭的主要益处和指征是减轻症状和改善心功能，适用于已经使用利尿药、ACEI（或 ARB）和 β 受体拮抗药治疗而仍持续有症状的慢性收缩性心力衰竭或合并心室率快的房颤患者。重症患者可同时应用上述四类药物。

(6) 醛固酮受体拮抗药：螺内酯适用于心功能Ⅲ～Ⅳ级的中、重度心力衰竭患者，或急性心肌梗死后合并心力衰竭且 LVEF < 40% 的患者。

4.1.1.2 急性心力衰竭

急性心力衰竭是指由于心功能异常导致症状和体征急性发作的临床综合征，可发生在有心脏病或既往无明确心脏病的患者。急性心力衰竭最常见的原因为慢性心力衰竭失代偿，其他原因或诱发因素包括急性冠状动脉综合征、急性快速心律失常、高血压危象、心瓣膜关闭不全、高心排血量综合征、过度劳累、感染或容量负荷过重等。急性心力衰竭属危重急症，需紧急进行抢救与治疗。

急性心力衰竭的治疗目的是通过降低肺毛细血管楔压和（或）增加心排血量，改善症状并稳定血流动力学状态。在药物治疗的同时，需进行严密的临床监测，尽可能去除或避免诱发因素，积极治疗基础疾病如冠心病、高血压、心脏瓣膜病或甲状腺疾病等。

为了尽快达到疗效，急性期通常采用静脉给药，根据患者的收缩压和肺淤血情况，分别选用利尿药、血管扩张药和（或）正性肌力药。

(1) 利尿药：首选静脉应用呋塞米，其利尿作用强大。

(2) 血管扩张药：静脉扩张药硝酸酯类能降低心脏前负荷，可缓解肺淤血而不增加心肌耗氧量。包括硝酸甘油和硝酸异山梨酯，常静脉应用。硝酸甘油疗效不佳或伴高血压危象时静脉滴注血管扩张药硝普钠。硝普钠可有效降低心脏前后负荷。

(3) 正性肌力药：外周低灌注的患者可使用正性肌力药物。但通常限于短期应用，因为其改善血流动力学参数的益处会被增加心律失常、加重心肌缺血的危险所抵消，总体上可能对预后不利。多巴酚丁胺或中等剂量的多巴胺均可用，但若患者已在使用 β 受体拮抗药，则宜选用磷酸二酯酶抑制药米力农。毛花苷 C 主要适用于心房颤动合并快速心室率所诱发的慢性心力衰竭急性失代偿，有助于尽快控制心室率、缓解症状。

4.1.2 正性肌力药

正性肌力药（positive inotropic drug）又称正变力性药物或强心药，是指能够增强心肌收缩力的药物，使心肌收缩敏捷而有力、心排血量明显增加、左心室压力上升的最大速率加快，从而改善心力衰竭时的血流动力学状况。主要用于治疗急慢性心力衰竭。

常用的正性肌力药物主要分为两大类①洋地黄苷类，如地高辛、毒毛花苷 K、毛花苷 C 和去乙酰毛花苷。②其他正性肌力药，包括儿茶酚胺类强心药（如多巴酚丁胺和多巴胺、磷酸二酯酶抑制药（如米力农）。肾上腺素和异丙肾上腺素也属于儿茶酚胺类强心药，但很少用于治疗心力衰竭。

地高辛在慢性心力衰竭患者中长期使用的安全性已得到证实。但急性心肌梗死后心力衰竭患者使用洋地黄存在肌酸激酶增高和促发严重心律失常的危险。因此，不推荐洋地黄糖苷类药物用于急性心肌梗死并发的心力衰竭。洋地黄糖苷类用于急性心力衰竭或慢性心力衰竭急性失代偿时。

儿茶酚胺类强心药和磷酸二酯酶抑制药通常只能短期使用，不推荐常规间歇静脉滴注。正性肌力药的适应证：①经最佳剂量利尿药和血管扩张药物治疗后仍然存在外周灌注不足（临床表现为低血压和肾

功能下降）的急性心力衰竭患者，目的是提供正性肌力支持、纠正血流动力学异常和缓解症状；②难治性终末期心力衰竭患者，作为姑息疗法短期应用（3～5日），或用于等待心脏移植的患者。

4.1.2.1 洋地黄苷类

地高辛[基（基），保（甲）]

Digoxin

【适应证】用于急、慢性心力衰竭，控制心房颤动，心房扑动引起的快速心室率，室上性心动过速。

【注意事项】(1) 本品可通过胎盘屏障，故妊娠后期母体用量可能增加，分娩后6周须减量。(2) 本品可排入乳汁，哺乳期妇女应用须权衡利弊。(3) 下列情况慎用，如低钾血症、不完全性房室传导阻滞、高钙血症、甲状腺功能减退、缺血性心脏病、急性心肌梗死早期、活动性心肌炎、肾功能不全。(4) 新生儿对本品的耐受性不定，其肾清除减少；早产儿与未成熟儿对本品敏感，按其不成熟程度而减小剂量。按体重或体表面积，1个月以上婴儿比成人用量略大。(5) 老年人应用时，因肝肾功能不全，表观分布容积减小或电解质平衡失调者，对本品耐受性低，必须减少剂量。(6) 用药期间，应定期监测地高辛血药浓度，血压、心率及心律，心电图，心功能，电解质尤其是钾、钙、镁，肾功能。疑有洋地黄中毒时，应做地高辛血药浓度测定。过量时，由于蓄积性小，一般停药后1～2日中毒表现可以消退。(7) 应用本品剂量应个体化。(8) 不能与含钙注射剂合用。

【禁忌证】(1) 任何洋地黄类制剂中毒者。(2) 室性心动过速、心室颤动、肥厚型梗阻性心肌病（若伴收缩功能不全或心房颤动仍可考虑）。(3) 预激综合征伴心房颤动或心房扑动者。

【不良反应】常见心律失常、食欲缺乏、恶心、呕吐、下腹痛、无力和软弱；少见视物模糊、色视、腹泻、中枢神经系统反应如精神抑郁或错乱；罕见嗜睡、头痛、皮疹和荨麻疹。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量一次0.125～0.5 mg，一日1次，7日可达稳态血药浓度，若快速负荷量，可一次0.25 mg，每6～8小时1次，总剂量一日0.75～1.25 mg；维持量一次0.125～0.5 mg，一日1次。②儿童一日总量早产儿按体重0.02～0.03 mg/kg；1个月以下新生儿按体重0.03～0.04 mg/kg；1个月～2岁，按体重0.05～0.06 mg/kg；2～5岁，按体重0.03～0.04 mg/kg；5～10岁，按体重0.02～0.035 mg/kg；10岁或10岁以上，照成人常用量。总量分3次或每6～8小时1次给予，维持剂量为总量的1/5～1/3，每12小时1次或一日1次。(2) 静脉注射：①成人常用量一次0.25～0.5 mg，用5%葡萄糖注射液稀释后缓慢注射，以后可用0.25 mg，每隔4～6小时按需注射，但一日总量不超过1 mg；不能口服者需静脉注射，维持量0.125～0.5 mg，一日1次。②儿童按下列剂量分3次或每6～8小时给予。早产新生儿按体重0.015～0.025 mg/kg；足月新生儿按体重0.02～0.03 mg/kg；1个月～2岁按体重0.04～0.05 mg/kg；2～5岁按体重0.025～0.03 5mg/kg；5～10岁按体重0.015～0.03 mg/kg；10岁或10岁以上按照成人常用量。

【制剂与规格】地高辛片：0.25 mg。

地高辛注射液：2 ml：0.5 mg

毒毛花苷K[保（甲）]

Strophanthin K

【适应证】用于急性心力衰竭（特别适用于洋地黄无效者），心率正常或心率缓慢的心房颤动的急性心力衰竭患者。

【注意事项】见地高辛。

【禁忌证】本品毒性剧烈，过量时可引起严重心律失常；近1周内用过洋地黄制剂者，不宜应用，以免中毒危险；已用全效量洋地黄者禁用，停药7日后慎用；不宜与碱性溶液配伍。

【不良反应】见地高辛。

【用法与用量】静脉注射：①成人常用量，首剂0.125～0.25 mg，加入5%葡萄糖注射液20～40ml后缓慢注入，时间不少于5分钟，按需要可2小时后重复一次0.125～0.25 mg，总剂量一日

0.25～0.5 mg。极量一次 0.5 mg，一日 1 mg。病情好转后，可改用洋地黄口服制剂。②儿童常用量，一日按体重 0.007～0.01 mg/kg 或按体表面积 0.3 mg/m^2，首剂给予一半剂量，其余分成几个相等部分，间隔 0.5～2 小时给予。

【制剂与规格】毒毛花苷 K 注射液：1 ml ∶ 0.25 mg。

毛花苷 C（毛花苷丙）[保（甲）]

Lanatoside C

【适应证】用于急性心力衰竭或慢性心力衰竭急性加重，控制快速心室率的心房颤动、心房扑动的心室率。

【注意事项】见地高辛。

【禁忌证】见地高辛。

【不良反应】见地高辛。

【用法与用量】静脉注射。首剂 0.4～0.6 mg，用 5% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释后缓慢注射，需要时可 2～4 小时后再给 0.2 mg；维持剂量一次 0.2～0.4 mg，一日 1 次或每 12 小时 1 次。情况紧急时，0.4～0.6 mg 以 25% 葡萄糖液稀释后静脉注射（5 分钟以上），2～4 小时后需要时再给 0.2～0.4 mg。起效后可改口服洋地黄制剂。

【制剂与规格】毛花苷 C 注射液：2 ml∶0.4 mg。

去乙酰毛花苷[基（基）、保（甲）]

Deslanoside

【适应证】用于急性心力衰竭，慢性心力衰竭急性加重，控制心房颤动、心房扑动引起的快心室率。

【注意事项】见地高辛。

【禁忌证】见地高辛。

【不良反应】见地高辛。

【用法与用量】肌内注射或静脉注射：①成人，用 5% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释后缓慢静脉注射，2 周内未用过洋地黄毒苷，或在 1 周内未用过地高辛的患者，初始剂量 0.4～0.6 mg，以后每 2～4 小时可再给 0.2～0.4 mg，总量一日 1～1.6 mg。②儿童，按下列剂量分 2～3 次间隔 3～4 小时给予。早产儿和足月新生儿或肾功能减退、心肌炎患儿，肌内注射或静脉注射，一日 0.022 mg/kg；2 周～3 岁，一日 0.025 mg/kg。静脉注射获满意疗效后，可改用地高辛常用维持量。

【制剂与规格】去乙酰毛花苷注射液：2 ml∶0.4mg。

4.1.2.2 磷酸二酯酶抑制药类

米力农[保（乙）]

Milrinone

【适应证】用于对洋地黄、利尿药、血管扩张药治疗无效或欠佳的急、慢性顽固性充血性心力衰竭。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肝肾功能损害、低血压、心动过速、急性心肌梗死、急性缺血性心脏病、孕妇及哺乳期妇女、儿童。(2) 本品仅限于短期使用，长期使用增加死亡率。(3) 用药期间应监测心率、心律、血压，必要时调整剂量。(4) 对房扑、房颤患者，因可增加房室传导作用导致心室率增快，宜先用洋地黄制剂控制心室率。(5) 合用强利尿药时，可使左室充盈压过度下降，且易引起水、电解质失衡。

【禁忌证】对本药过敏者、严重低血压、严重室性心律失常、严重瓣膜狭窄病变、肥厚型梗阻性心肌病。

【不良反应】少见头痛、室性心律失常、无力、血小板计数减少；过量时可有低血压、心动过速。

【用法与用量】静脉注射：负荷量 25～75 μg/kg，5～10 分钟缓慢静脉注射，以后每分钟 0.25～1.0μg/kg 速度维持。最大剂量一日 1.13 mg/kg。

【制剂与规格】注射用米力农：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

米力农注射液：5 ml∶5 mg。

米力农葡萄糖注射液：100 ml∶20mg，葡萄糖 5.45 g。

米力农氯化钠注射液：100 ml∶20 mg，氯化钠 0.86 g。

乳酸米力农注射液：① 10ml∶10 mg；② 20 ml∶20 mg。

4.1.2.3 其他正性肌力药

本类药包括儿茶酚胺类，主要有多巴酚丁胺、多巴胺。

4.2 心律失常用药

4.2.1 心律失常及其药物治疗

心律失常（arrhythmia）是指心脏跳动节律和（或）频率的异常，其发生机制是由于冲动形成异常和冲动传导异常。心律失常可发生在各种器质性心脏病患者，也可发生在心脏结构正常的人。心律失常的临床意义及其治疗决策取决于该类心律失常对患者血流动力学影响的大小。心律失常的主要诊断方法包括心脏听诊、心电图、动态心电图、心电生理检查等。

临床可根据心律失常时心率的快慢，分为快速性心律失常和缓慢性心律失常。快速性心律失常包括期前收缩、心动过速、扑动、颤动；缓慢性心律失常包括停搏、心动过缓、传导阻滞等。

4.2.1.1 快速性心律失常

（1）期前收缩：可根据期前收缩的起搏点位置分为房性、交界性、室性。

①房性期前收缩（premature atrial complexes）。通常无临床症状，60%正常人可出现。无症状者不需要治疗。有症状者可少量服用镇静药或 β 受体拮抗药。

②交界性期前收缩（premature AV junctional complexes）。少见，自律性高者多伴有器质性心脏病或洋地黄中毒。治疗可针对病因本身。

③室性期前收缩（premature ventricular complexes）。临床最常见，可发生在各类器质性心脏病患者，也可在正常人出现。治疗应综合考虑原发病的程度、期前收缩的频率及患者的自觉症状。有明确病因者应治疗原发病。就室性期前收缩本身，如有症状可首选口服 β 受体拮抗药，也可短期选用 IB 类的美西律、IC 类的普罗帕酮。如伴有心肌缺血、心力衰竭、症状明显的高危患者应选用Ⅲ类抗心律失常药物，如胺碘酮。

（2）心动过速：临床常见的心动过速有窦性心动过速、房性心动过速、室上性心动过速、室性心动过速。

①窦性心动过速（sinus tachycardia）。常属正常生理反应，非生理性者多由于交感神经张力过高所致，无须特殊治疗。若有症状者可选用 β 受体拮抗药。

②房性心动过速（atrial tachycardia）。多伴发器质性心脏病，如冠心病、肺心病、洋地黄中毒等。诊断主要依靠心电图。洋地黄中毒所致者应首先停用洋地黄，反复发作者可选用 β 受体拮抗药、维拉帕米、地尔硫䓬；对伴有心力衰竭者应选用胺碘酮。射频消融术治疗的成功率可达 80%以上。

③室上性心动过速（supraventricular tachycardia）。大多数患者临床表现为心律失常发作突然，心率一般为每分钟 150～220 次，发作可持续几分钟至数十小时，可诱发患者出现心绞痛、心力衰竭等。诊断主要依据心电图检查。窄 QRS 波心动过速发作的终止方法可首选刺激迷走神经的手法、经食管快速心房起搏法。药物治疗可选用静脉注射腺苷。对于心功能正常、窄 QRS 波心动过速、近期未使用 β 受体拮抗药的患者，可选用静脉注射维拉帕米或普罗帕酮。如有明显心功能不全，则可选用洋地黄苷或胺碘酮静脉注射。同步电击复律可获得迅速的缓解。急性宽 QRS 波心动过速，应首选直流电转复。抗心律失常药物可选用普罗帕酮、索他洛尔，伴有心功能不全者选用胺碘酮更为安全。射频消融术是根治阵发性室上性心动过速的最佳选择。

④室性心动过速（ventricular tachycardia）。常发生于各种器质性心脏病，最常见为冠心病，特别是急性心肌梗死发病 24 小时以内。其次可见于心肌病、重症急性心肌炎、心力衰竭、电解质紊乱、长 QT 综合征等。持续性的快速室性心动过速常可导致心室颤动、发生猝死。诊断主要依据心电图检查。临床危险程度除了与原发疾病相关，还取决于发作持续时间、有无血流动力学障碍。

室性心动过速的治疗原则：如无症状或无血流动力学影响，处理原则与室性期前收缩相同。持续性室性心动过速发作，无论有无器质性心脏病和（或）有无血流

动力学影响，都应及时终止。首选为静脉注射利多卡因，亦可选用静脉注射普罗帕酮，但不宜用在急性心肌梗死或伴有心力衰竭患者。此时，胺碘酮是最常选用的药物。如患者已发生休克、心绞痛、心力衰竭等临床表现，则应立即采用直流电复律。

尖端扭转型室性心动过速（torsades de pointes）是室性心律失常的一个特殊类型，常见于心电图 QT 间期延长的患者（通常是药物引起的，其他的致病因素包括低血钾、严重的心动过缓和遗传因素）。这种发作通常有自限性的，但如频繁发作亦会导致严重血流动力学障碍，甚至进展为心室颤动。静脉给予硫酸镁通常是有效的。β 受体拮抗药及心房或心室起搏也可考虑。

（3）颤动与扑动

①心房颤动（atrial fibrillation）是临床十分常见的心律失常，可分为阵发性、持续性和永久性三个类型。房颤常发生于原有心血管病的患者，如冠心病、心瓣膜病等器质性心脏病；非心血管疾病伴发房颤则最常见于甲状腺功能亢进症。房颤的症状取决于心室率的快慢，长期快速心室率的房颤可导致心力衰竭，房颤并发体循环栓塞具有极高的风险性。

对房颤的治疗策略包括节律转复，心室率控制和抗凝治疗三个方面。

节律转复：新近发生的房颤，对血流动力学不能耐受的房颤，或反复发作产生明显症状的患者，可以考虑按相关治疗指南的要求进行房颤律转复。电复律应是首选的转复手段，如采用药物转复，目前最常用的静脉复律药物是普罗帕酮和胺碘酮。心功能正常或无器质性心脏病，亦可口服普罗帕酮、索他洛尔转复，如有心功能不全或器质性心脏病，应首选胺碘酮。房颤复律后一般均需要使用上述有效抗心律失常药物来维持治疗。目前，奎尼丁、普鲁卡因胺、丙吡胺等药物已很少选用。

控制心室率：β 受体拮抗药、地尔硫䓬和维拉帕米作为一线治疗用来控制房颤患者的心室率；伴有心力衰竭的患者首选地高辛；难治患者亦可选用胺碘酮。如心率控制不满意，则地尔硫䓬或维拉帕米可与地高辛联用，但要密切注意观察心功能的减退状况。

抗凝治疗：在心脏瓣膜病、心肌疾病、老年患者中和其他有血栓栓塞危险因素的房颤患者有使用抗凝药的指征。首选药物为华法林。对于老年患者需要进行总体受益或风险的评估。对于无器质性心脏病的年轻患者患孤立性房颤则不强调需要抗凝治疗，但建议服用抗血小板聚集药，如阿司匹林或氯吡格雷。

②心房扑动（atrial flutter）：β 受体拮抗药、地尔硫䓬、维拉帕米和地高辛可用来控制静息时的心室率。如有指征，可通过同步电击复律转复为窦性心律。此外，胺碘酮也可用来转复心律，并可用胺碘酮或索他洛尔来维持窦律。如果心律失常是长期的，在转复为窦律之前应给予抗凝药来避免栓塞的并发症。I 型房扑应首选射频消融治疗。

③心室颤动（ventricular fibrillation）及心室扑动（ventricular flutter）：常见于急性心肌梗死等严重器质性心脏病、药物中毒、电解质紊乱等患者，并多见于心脏性猝死。治疗措施为积极抢救，按心肺脑复苏原则进行。最佳方法为非同步直流电除颤复律术。肾上腺素为主要抢救药物，酌情选用利多卡因、溴苄胺等。

4.2.1.2 缓慢性心律失常

（1）心动过缓

①窦性心动过缓（sinus bradycardia）：常为正常生理状况，也可见于某些心脏、全身性疾病、药物引起等。无症状者一般无需处理，有症状者则针对病因处理，迷走神经张力增高者可使用阿托品，症状重者需用起搏器治疗。

②病态窦房结综合征（sick sinus syndrome）：是由于窦房结及其周边组织病变或功能障碍导致的心律失常，多为器质性心脏病所致。心电图为心动过缓、窦性停搏、窦房阻滞。部分患者在心动过缓的基础上出现快速性异位节律，如心房颤动等。临床主要表现为心绞痛、晕厥，重者出现阿－斯综合征。植入起搏器为首选治疗方法，阿托品可试用，但多数疗效欠佳。

（2）停搏：窦性停搏（sinus pause or sinus arrest）为窦房结在一段时期内

不产生冲动，导致心室在相当时间内出现收缩停止。其病因多数为器质性心脏病引起，个别也可由迷走神经张力过高所致。治疗原则与窦性心动过缓及病态窦房结综合征相同。

(3) 传导阻滞。房室传导阻滞（atrio-ventricular block)。为房室交界区对冲动传导时间延缓或阻断所致。根据阻滞程度可分为一、二、三度。

①一度房室传导阻滞。指房室间传导时间延长＞0.20秒，房室传导比例仍为1∶1。临床多见于生理性，也可见于心肌炎、缺血性心脏病、心肌病等。

②二度房室传导阻滞。根据房室传导特点又可分为两型（Ⅰ型及Ⅱ型)。二度Ⅰ型可为生理性，若为病理性的亦常为一过性或可逆性的。心电图表现为房室传导时间逐渐延长，最终发生心室搏动脱落，而后房室传导时间再次缩短，重复发生上述现象，并周而复始。二度Ⅱ型则多数为病理性，如缺血性心脏病、心肌炎、心肌病等。心电图表现为房室传导时间固定，但在若干周期后可出现一次或数次心室搏动脱落。

③三度房室传导阻滞。为完全性房室传导阻滞，心电图表现为心房与心室的收缩完全分离，属于严重的心律失常。多数患者为重症心脏疾病，如急性心肌梗死、急性心肌炎等。

房室传导阻滞的治疗。一度患者多无特殊临床症状，无须治疗或仅作病因治疗。二度患者的处理主要取决于病因及临床症状。一般生理性二度Ⅰ型无须特殊处理，病理性的二度Ⅰ型主要为病因治疗，如因心动过缓可应用阿托品。二度Ⅱ型及三度患者则都必须治疗，原则上心室率＜每分钟50次，应首选起搏器治疗。在无条件时可短期应用阿托品或β肾上腺素受体兴奋药，如异丙肾上腺素。

4.2.2 各类抗心律失常药

抗心律失常药可根据它们作用于心肌细胞的电活动的机制分为如下几类。

(1) Ⅰ类：膜稳定药（钠通道阻滞药)。

① ⅠA类，如奎尼丁、普鲁卡因胺、丙吡胺、安他唑啉。

② ⅠB类，如利多卡因、美西律、苯妥英钠、阿普林定。

③ ⅠC类，如普罗帕酮、莫雷西嗪。

(2) Ⅱ类：β肾上腺素受体拮抗药，如普萘洛尔、美托洛尔、比索洛尔、阿替洛尔、艾司洛尔。

(3) Ⅲ类：钾通道阻滞药，如胺碘酮、索他洛尔（也有Ⅱ类作用)、溴苄铵。

(4) Ⅳ类：钙通道阻滞药，如维拉帕米（不包括二氢吡啶类钙通道阻滞药)。

(5) 其他：不属于上述分类而具有抗心律失常的药物，如腺苷。

(6) 注意：抗心律失常药有附加的负性肌力作用，尤其对于有器质性心脏病，合并心功能有损害或心肌缺血的患者。必须指出，抗心律失常药物在某种条件下都可引起心律失常（致心律失常作用)。另外，低血钾能增强很多药物的致心律失常作用。

4.2.2.1 Ⅰ类膜稳定药

4.2.2.1.1 ⅠA类

奎尼丁[保(甲)]

Quinidine

【适应证】用于心房颤动或心房扑动经电转复后的维持治疗。

【注意事项】(1) 肝功能不全者半衰期延长。长期用药需监测肝功能，若肝功能异常需立即停药。(2) 长期用药需监测肾功能，若肾功能异常需立即停药。血液透析可促使原型药及代谢物的清除。(3)本品可通过胎盘屏障，妊娠期妇女使用时应权衡利弊。(4) 本品可通过乳汁分泌，哺乳期妇女不建议服用本品。(5) 对可能发生完全性房室传导阻滞而无起搏器保护的患者应慎用。(6) 转复心房扑动或心房颤动时，应先用洋地黄制剂或β受体拮抗药，以免心室率过快。(7) 当一日口服量超过1.5g时，或给有不良反应的高危病人用药，应住院，监测心电图及血药浓度。一日超过2g时应特别注意心脏毒性。(8) 长期用药需监测肝、肾功能，若出现严重电解质紊乱或肝、肾功能损害时需立即停药，加强心电图监测，QRS间期超过药前20%应停药。

【禁忌证】对本品过敏者、本品曾引

起血小板减少性紫癜者、没有起搏器保护的二度或三度房室传导阻滞、病窦综合征者。

【不良反应】(1) 促心律失常：心脏停搏、传导阻滞、室性心动过速、心室颤动等。(2) 心电图改变：出现PR间期延长、QRS波增宽，QT间期明显延长，可诱发室性心动过速（扭转性室性心动过速）或心室颤动、发作时伴晕厥（奎尼丁晕厥现象）、低血压。(3) 消化系统表现：恶心，呕吐，痛性痉挛，腹泻，食欲缺乏。(4) 金鸡纳反应：耳鸣、胃肠道障碍、心悸、惊厥、头痛及面部潮红、视力障碍、听力障碍、发热、局部水肿、眩晕、震颤、忧虑、兴奋、昏迷，甚至死亡。(5) 特异质反应：头晕，冷汗，休克，青紫，呼吸抑制或停止（与剂量无关）。(6) 过敏反应：皮疹，尤以荨麻疹、瘙痒多见，发热、哮喘、肝炎及虚脱（与剂量无关）；使重症肌无力加重，使CPK酶增高；血小板减少，急性溶血性贫血，粒细胞减少，白细胞分类左移，中性粒细胞减少。

【用法与用量】口服：餐后2小时或餐前1小时服药，并多次饮水。成人应先试服0.1～0.2g，观察有无过敏及特异质反应。成人常用量一次0.2～0.3g，一日3～4次。用于转复心房颤动或心房扑动：第1日，一次0.2g，2小时1次，连续5次；如无不良反应，第2日一次0.3g，第3日一次0.4g，约2小时1次，连续5次。一日总量不宜超过2.4g。若连服3～4日无效或出现不良反应，应停药。恢复窦性心律后改为维持量，一次0.2～0.3g，一日2～3次。成人极量一日3g（一般一日不宜超过2.4g），应分次给予。

【制剂与规格】硫酸奎尼丁片：0.2g。

普鲁卡因胺[基(基)，保(甲)]

Procainamide

【适应证】用于危及生命的室性心律失常。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应。对普鲁卡因及其他有关药物过敏者，可能对本品也过敏。(2) 本品可透过胎盘屏障在胎儿体内蓄积，妊娠及哺乳期妇女应用时需权衡利弊。(3) 下列情况慎用，如过敏患者、支气管哮喘、肝肾功能障碍、低血压、心脏收缩功能明显降低者。(4) 小儿常用量尚未确定，可参考以下资料。按体重3～6mg/kg，静脉注射5分钟，静脉滴注维持量为每分钟按体重0.025～0.05mg/kg。(5)老年人应酌情调整剂量。(6) 用于治疗房性心动过速时需在使用地高辛的基础上应用。(7) 静脉应用易出现低血压，静脉用药速度要慢。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 病态窦房结综合征（除非已有起搏器）、二或三度房室传导阻滞（除非已有起搏器）、红斑狼疮（包括有既往史者）、低钾血症、重症肌无力者。(3) 地高辛中毒者。

【不良反应】可见心脏停搏、传导阻滞及室性心律失常、心电图出现QRS波增宽、PR及QT间期延长、“Ron T”、多型性室性心动过速或心室颤动、严重低血压，心脏传导异常、口苦、恶心、呕吐、腹泻、肝大、ALT及AST升高、荨麻疹、瘙痒、血管神经性水肿及斑丘疹；另见红斑狼疮样综合征，发热、寒战、关节痛、皮肤损害、腹痛等；头晕，精神抑郁及伴幻觉的精神失常，溶血性或再生不良性贫血，粒细胞减少，嗜酸性细胞增多，血小板减少及骨髓肉芽肿，血浆凝血酶原时间及部分凝血活酶时间延长，肉芽肿性肝炎及肾病综合征，进行性肌病及Sjogren综合征。

【用法与用量】(1) 口服：一次0.25～0.5g，每4小时1次。(2) 静脉注射：一次0.1g，静脉注射时间5分钟，必要时每隔5～10分钟重复一次，总量按体重不得超过10～15mg/kg；或者10～15mg/kg静脉滴注1小时，然后以每小时按体重1.5～2mg/kg维持。

【制剂与规格】盐酸普鲁卡因胺片：0.25g。

盐酸普鲁卡因胺注射液：1ml：0.1g。

丙吡胺[保(乙)]

Disopyramide

【适应证】用于其他药物无效的危及生命的室性心律失常。

【注意事项】(1) 肝功能不全者应适当减量。(2) 肾功能受损者应依据肾功能

适当减量，肾衰竭时应慎用。血液透析可清除本品，故透析后可能需加量。(3) 本品可通过胎盘屏障，已报道可引起妊娠期妇女子宫收缩。(4) 乳汁中可能有较高的药物浓度。(5) 下列情况慎用，如对本品过敏者、一度房室或室内阻滞、肾衰竭、未经治疗控制的充血性心力衰竭或有心力衰竭史者、广泛心肌损害、低血压、肝功能受损者、低钾血症。(6) 老年人及肾功能受损者应根据肾功能适当减量。(7) 用药期间应监测血压、心电图（QRS 增宽超过 25% 时应停药）、心功能、肝肾功能、眼压和血清钾。(8) 心肌病或可能产生心功能不全者不宜服用负荷剂量，并应严密监测血压及心功能情况。(9) 服用硫酸奎尼丁或盐酸普鲁卡因胺者如需换用本品，应先停服硫酸奎尼丁 6 ~ 12 小时或盐酸普鲁卡因胺 3 ~ 6 小时。

【禁忌证】二或三度房室传导阻滞及双束支传导阻滞（除非已有起搏器）、病态窦房结综合征、心源性休克、青光眼、尿潴留、重症肌无力者。

【不良反应】可见口干、尿潴留、尿频、尿急、便秘、视物模糊、青光眼加重等；恶心、呕吐、食欲减退、腹泻；呼吸暂停、神志丧失、心脏停搏、传导阻滞及室性心律失常、心电图 PR 间期延长、QRS 波增宽及 QT 延长、扭转性室性心动过速及心室颤动、心力衰竭复发或加重、低血压、休克；肝脏胆汁淤积、肝功能不正常、粒细胞减少、失眠、精神抑郁或失常、低血糖、阳痿、水潴留；静脉注射时血压升高，过敏性皮疹，光敏性皮炎，潮红及紫癜也偶有发生。

【用法与用量】口服：成人首剂 0.2 g，以后一次 0.1 ~ 0.15 g，每 6 小时 1 次。应根据需要及耐受程度调整用量。

【制剂与规格】磷酸丙吡胺片：0.1 g。

安他唑啉

Antazoline

【适应证】用于房性、室性期前收缩，室性心动过速，房颤等心律失常及过敏性疾病。

【注意事项】器质性心脏病，心排血量不足者慎用。

【禁忌证】心力衰竭患者。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、嗜睡、粒细胞减少。

【用法与用量】口服：一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 3 ~ 4 次，餐后服用。

【制剂与规格】盐酸安他唑啉片：0.1 g。

4.2.2.1.2 ⅠB 类

利多卡因 [基（基）、保（甲）]

Lidocaine

【适应证】用于急性心肌梗死后室性期前收缩和室性心动过速，洋地黄类中毒、心脏外科手术及心导管引起的室性心律失常。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肝功能不全及肝血流降低、肾功能不全、充血性心力衰竭、严重心肌受损、低血容量者、休克者、孕妇。(2) 新生儿用药可引起中毒，早产儿较正常儿半衰期长。(3) 老年人用药应根据需要及耐受程度调整剂量，> 70 岁患者剂量应减半。(4) 用药期间应注意监测血压、监测心电图，并备有抢救设备；心电图 PR 间期延长或 QRS 波增宽，出现其他心律失常或原有心律失常加重者应立即停药。

【禁忌证】阿 - 斯综合征（急性心源性脑缺血综合征），预激综合征，严重心传导阻滞（包括窦房、房室及心室内传导阻滞）。

【不良反应】头晕、眩晕、恶心、呕吐、倦怠、言语不清、感觉异常、肌肉震颤、惊厥、神志不清、呼吸抑制；低血压、窦性心动过缓、心脏停搏、房室传导阻滞、心肌收缩力减弱、心排血量下降；红斑皮疹、血管神经性水肿。

【用法与用量】(1) 静脉注射：首次 50 ~ 100 mg，缓慢静脉注射 2 ~ 3 分钟，必要时每 5 分钟重复，1 ~ 2 次，但 1 小时之内的总量不得超过 300 mg。最大维持量为每分钟 4 mg。(2) 静脉滴注：一般以 5% 葡萄糖注射液配成 1 ~ 4 mg/ml 药液滴注或用输液泵给药。在用负荷量后可继续以每分钟 1 ~ 4 mg 速度静脉滴注。老年人、心力衰竭、心源性休克、肝血流量减少、肝或肾功能障碍时，以每分钟 0.5 ~ 1 mg 静脉滴注，每小时不超过

100 mg。

【制剂与规格】盐酸利多卡因注射液：① 5 ml∶50 mg；② 5 ml∶100 mg；③ 10 ml∶200 mg；④ 20 ml∶400 mg。

（其他见 17.3）

美西律[基（基）. 保（甲）]

Mexiletine

【适应证】用于慢性室性心律失常。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如低血压、严重充血性心力衰竭、室内传导阻滞、严重窦性心动过缓、肝肾功能不全。(2) 老年人应用时应监测肝功能。(3) 用药期间应定期检查血压、心电图、血药浓度。

【禁忌证】心源性休克、二或三度房室传导阻滞、病窦综合征、哺乳期妇女。

【不良反应】恶心、呕吐、肝功能损害、头晕、震颤、共济失调、眼球震颤、嗜睡、昏迷及惊厥、复视、视物模糊、精神失常、失眠、窦性心动过缓及窦性停搏、胸痛、室性心动过速、低血压、心力衰竭、皮疹、极个别有白细胞及血小板减少。

【用法与用量】(1) 口服：首次 200～300 mg，必要时 2 小时后再服 100～200 mg。一般维持量一日 400～800 mg，分 2～3 次服。成人极量为一日 1 200 mg，分 3 次口服。(2) 静脉注射：开始 100 mg，加入 5%葡萄糖液 20 ml 中，缓慢静脉注射 3～5 分钟。如无效，可在 5～10 分钟后再给 50～100 mg。然后以每分钟 1.5～2 mg 的速度静脉滴注 3～4 小时以后滴速减至每分钟 0.75～1 mg，并维持 24～48 小时。

【制剂与规格】盐酸美西律片：① 50 mg；② 100 mg。

盐酸美西律胶囊：100 mg。

盐酸美西律注射液：2 ml∶100 mg。

阿普林定

Aprindine

【适应证】用于频发的室性和房性期前收缩，阵发性室性和房性心动过速，预激综合征合并心动过速等。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如有器质性心脏病的患者（特别是有心肌缺血和心功能不全者）、帕金森病、有精神病史者、肝肾功能不全者、孕妇及哺乳期妇女。(2) 儿童及老年患者慎用，用量酌减。(3) 用药期间应定期检查血常规、肝肾功能、心电图。(4) 个别患者如有眩晕、感觉异常、恶心、手颤等不良反应，减量或停药即可消失。

【禁忌证】中、重度房室传导阻滞及重度室内传导阻滞患者，有癫痫样发作史者、黄疸或血常规异常、严重心功能不全者、对本品过敏者。

【不良反应】眩晕，共济失调，感觉异常，幻视，复视，记忆障碍，手颤；严重的可发生癫痫样抽搐，亦可见恶心、呕吐，腹泻；偶见 ALT 升高，胆汁淤积性黄疸和粒细胞缺乏症等特异质反应。

【用法与用量】口服：成人初始剂量 100 mg，其后 6～8 小时 50～100 mg，当日不超过 300 mg，第 2 日和第 3 日内各 100～150 mg，分 2～3 次服，此后逐渐减至维持量，一日 50～100 mg，分 2 次服。

【制剂与规格】盐酸阿普林定片：① 25 mg；② 50 mg。

4.2.2.1.3 I C 类

普罗帕酮[基（基）保（甲）]

Propafenone

【适应证】用于阵发性室性心动过速及室上性心动过速，预激综合征者伴室上性心动过速，心房扑动或心房颤动的预防，各类期前收缩。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如严重心肌损害者、严重的心动过缓、肝肾功能不全者、明显低血压患者、孕妇及哺乳期妇女。(2) 老年患者用药后可能出现血压下降。且老年患者易发生肝、肾功能损害，因此要谨慎应用。老年患者的有效剂量较正常低。(3) 如出现窦房性或房室性传导高度阻滞时，可静脉注射乳酸钠、阿托品、异丙肾上腺素等解救。

【禁忌证】无起搏器保护的窦房结功能障碍、严重的房室传导阻滞、双束支传导阻滞者、严重充血性心力衰竭、心源性休克、严重低血压及对该药过敏者。

【不良反应】口干，唇舌麻木，头痛，

头晕，恶心，呕吐，便秘，胆汁淤积性肝损伤，房室传导阻滞，QT 间期延长，PR 间期轻度延长，QRS 时间延长等。

【用法与用量】(1) 口服：一次 100 ~ 200 mg，一日 3 ~ 4 次。维持量，一日 300 ~ 600 mg，分 2 ~ 4 次服用。(2) 静脉注射：一次 70 mg，加 5%葡萄糖液稀释，于 10 分钟内缓慢注射，必要时 10 ~ 20 分钟重复一次，总量不超过 210 mg。静脉注射后改为静脉滴注，滴速每分钟 0.5 ~ 1.0 mg 或口服维持。

【制剂与规格】盐酸普罗帕酮片：① 50 mg；② 150 mg。

盐酸普罗帕酮胶囊：① 50 mg；② 100 mg；③ 150 mg。

盐酸普罗帕酮注射液：① 5 ml : 17.5 mg；② 10 ml : 35 mg。

莫雷西嗪 [保 (乙)]

Moricizine

【适应证】用于室性期前收缩，室性心动过速。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如心肌梗死后无症状的非致命性室性心律失常、一度房室阻滞和室内阻滞、肝肾功能不全者、严重心力衰竭。(2) 用药期间应注意随访检查血压、心电图、肝功能。(3) 剂量应个体化，在应用本品前，应停用其他抗心律失常药物 1 ~ 2 个半衰期。

【禁忌证】二或三度房室传导阻滞及双束支传导阻滞且无起搏器者、心源性休克、对本品过敏者。

【不良反应】头晕，头痛，嗜睡，乏力；口干，恶心，呕吐，腹痛，消化不良；出汗，感觉异常，复视；致心律失常作用等。

【用法与用量】口服：成人常用量一次 150 ~ 300 mg，每 8 小时 1 次，一日最大剂量 900 mg。

【制剂与规格】盐酸莫雷西嗪片：50 mg。

4.2.2.2 Ⅱ类 β 肾上腺素受体拮抗药

见 4.7。

4.2.2.3 Ⅲ类钾通道阻滞药

胺碘酮 [基 (基)，保 (甲)]

Amiodarone

【适应证】房性心律失常（心房扑动，心房颤动转律和转律后窦性心律的维持）；结性心律失常；室性心律失常（治疗危及生命的室性期前收缩和室性心动过速以及室性心动过速或心室颤动的预防）；伴预激综合征的心律失常。尤其上述心律失常合并器质性心脏病的患者（冠状动脉供血不足及心力衰竭）。口服适用于危及生命的阵发室性心动过速及心室颤动的预防，也可用于其他药物无效的阵发性室上性心动过速、阵发心房扑动、心房颤动，包括合并预激综合征者及持续心房颤动、心房扑动电转复后的维持治疗。可用于持续房颤、房扑时室率的控制。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如窦性心动过缓、QT 延长综合征、低血压、肝功能不全、严重充血性心力衰竭、肺功能不全、低钾血症。(2) 老年人应用时需严密监测心电图、肺功能。(3) 用药期间应定期检查血压、心电图（特别注意 QT 间期）、肝功能、甲状腺功能、肺功能、眼科检查。(4) 多数不良反应与剂量有关，需长期服药患者尽可能用最小维持剂量。(5) 本品口服作用的发生及消除均缓慢，临床应用根据病情而异。对危及生命的心律失常宜用短期较大负荷量，必要时静脉负荷；而对于非致命性心律失常，应用小量缓慢负荷。(6) 本品半衰期长，故停药后换用其他抗心律失常药时应注意相互作用。

【禁忌证】窦性心动过缓，窦房阻滞和病窦综合征，除非已安装起搏器（有窦性停搏的危险）；严重房室传导异常（除非已安装起搏器）；与能诱发尖端扭转性室性心动过速的药物合用；甲状腺功能异常；已知对碘、胺碘酮或其中任何赋形剂过敏；孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】窦性心动过缓、窦性停搏、房室传导阻滞，偶有 QT 间期延长伴扭转性室性心动过速；甲状腺功能亢进或减退；角膜黄棕色色素沉着；便秘、偶见恶心、呕吐、食欲缺乏；少见震颤、共济

失调、近端肌无力、锥体外体征；长期服药可有光敏感、皮肤石板蓝样色素沉着、皮疹、肝炎或脂肪浸润、转氨转酶增高、过敏性肺炎，肺间质或肺泡纤维性肺炎、小支气管腔闭塞、限制性肺功能改变；低血钙症及血清肌酐升高。

【用法与用量】(1) 口服：①用于治疗室上性心律失常，一日 0.4 ~ 0.6 g，分 2 ~ 3 次服，1 ~ 2 周后根据需要改为一日 0.1 ~ 0.4 g 维持，部分患者可减至一日 0.1 g，每周 5 日或更小剂量维持。②治疗严重室性心律失常，一日 0.6 ~ 1.2 g，分 3 次服用，1 ~ 2 周后根据需要逐渐改为一日 0.2 ~ 0.4 g 维持。建议维持量宜应用最小有效剂量，根据个体反应，可给予一日 0.1 ~ 0.4 mg。亦可隔日 0.2 mg 或一日 0.1 mg。(2) 静脉滴注：负荷量按体重 3 ~ 5 mg/kg，一般为 0.15 mg，加入 5% 葡萄糖溶液 250 ml，在 20 分钟内滴入（滴入时间不得短于 10 分钟)，然后以每分钟 1 ~ 1.5 mg 维持，6 小时后减至每分钟 0.5 ~ 1 mg，一日总量 1.2 mg。以后逐渐减量，静脉滴注胺碘酮持续不应超过 3 ~ 4 日。

【制剂与规格】盐酸胺碘酮片：① 0.1 g；② 0.2 g。

盐酸胺碘酮胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g。

盐酸胺碘酮注射液：① 2 ml : 150 mg；② 3 ml : 150 mg。

索他洛尔[保(乙)] 见 4.7。

溴苄铵

Bretylium

【适应证】各种病因所致的室性心律失常（如频发性期前收缩、阵发性室性心动过速、心室扑动和颤动)。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如肾功能不全、主动脉瓣狭窄、肺动脉高压及其他有心排血量减低的情况。(2) 一次肌内注射不宜超过 5 ml，并应变换注射部位。静脉注射时患者应取卧位。(3) 不宜与含钙离子的药物合用。(4) 因本品起效较慢，宜尽早用药。

【禁忌证】低血压者。

【不良反应】危急情况时用药可产生直立性低血压，开始用药时可能产生一过性心律失常加重或出现其他心律失常、心绞痛发作等；静脉注射过快时发生恶心及呕吐；其他较少见的有心动过缓、心律失常、心绞痛发作、腹泻及腹痛、过敏性皮疹、潮红、发热、出汗、鼻充血及轻度结膜炎、头晕、头痛等；个别病例高热。

【用法与用量】静脉注射或肌内注射：按体重一次 5 ~ 10 mg/kg，以 5% 葡萄糖注射液稀释后缓慢静脉注射，在 10 ~ 20 分钟内注完。必要时 4 ~ 6 小时后重复。也可在静脉注射出现疗效后，以肌内注射维持。

【制剂与规格】托西溴苄铵注射液：2 ml : 0.25 g。

4.2.2.4 Ⅳ类钙通道阻滞药

维拉帕米[基(基)，保(甲)]

Verapamil

【适应证】心绞痛，室上性心律失常，原发性高血压；注射剂用于快速阵发性室上性心动过速的转复，心房扑动或心房颤动心室率的暂时控制。

【注意事项】(1) 肝功能不全患者慎用。严重肝功能不全时，口服给予正常剂量的 30%，静脉给药时作用时间延长，反复用药可能导致蓄积。(2) 肾功能不全患者慎用，血液透析不能清除维拉帕米。(3) 孕妇避免使用，哺乳期妇女服用本品期间应暂停哺乳。(4) 下列情况慎用并需进行严密的医疗监护，如一度房室传导阻滞、低血压、心动过缓、严重肝功能损害、伴有 QRS 增宽（> 0.12 s）的室性心动过速、进行性肌营养不良、急性心肌梗死、与 β 肾上腺素受体拮抗药合用。(5) 老年人清除半衰期可能延长且易发生肝或肾功能不全，建议老年人从小剂量开始服用。(6) 用药期间应定期检查血压。(7) 由于个体敏感性的差异，使用本品时可能影响驾车和操作机器的能力，严重时可能使患者在工作时发生危险。这种情况更易出现于治疗开始、增加剂量、从其他药物换药或与乙醇同服时。(8) 不能与葡萄柚汁同时服用。

【禁忌证】对本品过敏，急性心肌梗死并发心动过缓、低血压、左侧心力衰竭，

心源性休克，病态窦房结综合征，严重的心脏传导功能障碍（如窦房传导阻滞，二或三度房室传导阻滞），预激综合征并发心房扑动或心房颤动，充血性心力衰竭。

【不良反应】常见便秘；偶见恶心、头晕、头痛、面部潮红、疲乏、神经衰弱、足踝水肿、皮肤瘙痒、红斑、皮疹，血管性水肿；罕见过敏、肌肉痛、关节痛、感觉异常；长期用药后出现齿龈增生，男性乳腺发育；静脉或大剂量给药可能出现低血压，心力衰竭，心动过缓，心脏传导阻滞，心脏停搏。

【用法与用量】(1) 口服：①成人。普通制剂。心绞痛，一次 80 ~ 120 mg，一日 3 次。心律失常，慢性心房颤动服用洋地黄者，一日 240 ~ 320 mg，分 3 ~ 4 次；预防阵发性室上性心动过速，未服用洋地黄者，一日 240 ~ 480 mg，分 3 ~ 4 次。原发性高血压，一次 40 ~ 80 mg，一日 3 次。最大使用剂量一日 480 mg。缓释制剂。原发性高血压，初始剂量一次 120 ~ 180 mg，一日 1 次。未达疗效时，在上一剂量 24 小时后增加剂量，可按下列方式进行。一日清晨 240 mg；一日清晨和傍晚各 1 次 180 mg；一日清晨 1 次 240 mg，傍晚 1 次 120 mg；每 12 小时 1 次 240 mg。缓释片剂不可掰开或嚼服。②儿童。普通制剂。心律失常，年龄 1 ~ 5 岁，按体重一日 4 ~ 8 mg/kg，分 3 次，或每 8 小时 40 ~ 80 mg；＞5 岁，每 6 ~ 8 小时 80 mg。(2) 静脉注射：必须在持续心电监测和血压监测下，缓慢静脉注射至少 2 分钟。无法确定重复静脉给药的最佳给药间隔，必须个体化治疗。初始剂量 5 ~ 10 mg（或 0.075 ~ 0.15 mg/kg），稀释后缓慢静脉注射至少 2 分钟。如初反应不满意，首剂 15 ~ 30 分钟后再给 1 次 5~10 mg 或 0.15 mg/kg。(3) 静脉滴注：加入氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液中静脉滴注，每小时 5 ~ 10 mg，一日总量不超过 50 ~ 100 mg。

【制剂与规格】盐酸维拉帕米片：40 mg。

盐酸维拉帕米缓释片：① 120 mg；② 180 mg；③ 240 mg。

盐酸维拉帕米缓释胶囊：① 120 mg；② 180 mg；③ 240 mg。

注射用盐酸维拉帕米：① 5 mg；② 10 mg。

盐酸维拉帕米注射液：2 ml : 5 mg。

4.2.3 其他抗心律失常药

腺苷

Adenosine

【适应证】阵发性室上性心动过速，超声心动图药物负荷试验。

【注意事项】(1) 严重肝功能不全者不可使用。(2) 肾功能不全者伴有止血缺陷者慎用。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 下列情况慎用，如存在一度房室传导阻滞及房室束传导分支阻滞者，自主神经功能障碍，瓣膜狭窄性心脏病，心包炎或心包积液，狭窄性颈动脉病，未校正容量减少者，与支气管狭窄无关的阻塞性肺部疾病，哮喘。(5) 对心力衰竭患者或先用 β 受体拮抗药者，用腺苷治疗室上速优于维拉帕米（可防止双重心肌抑制作用）。(6) 不宜长期用于预防阵发性室性心动过速。

【禁忌证】二或三度房室传导阻滞者或病窦综合征者（带有人工起搏器者除外）；心房颤动或扑动伴异常旁路者；已知或估计有支气管狭窄或支气管痉挛的肺部疾病患者；对本品过敏者。

【不良反应】常见恶心、头晕、潮红、呼吸困难，胸部不适；罕见低血压，上肢不适，ST 段压低，一或二度房室传导阻滞，神经过敏；严重的有背部不适，无力，出汗，心悸，嗜睡，腹痛，情绪不稳，咳嗽，视物模糊，口干，耳不适，金属味等；非致命的心肌梗死，三度房室传导阻滞，室性心动过速，心动过缓，窦房传导阻滞，窦性停搏等。

【用法与用量】(1) 静脉注射：成人，起始剂量为 6 mg，若 1 ~ 2 分钟未见症状改善，第二次或第三次给予 12 mg 直至症状改善。儿童，起始剂量按体重 0.05 ~ 0.1 mg/kg，依症状是否改善每隔 1 ~ 2 分钟以 0.05 ~ 0.1 mg/kg 的剂量缓慢增加直至症状改善但不超过最大剂量 0.25 ~ 0.3 4 mg/kg。(2) 诊断：成人按体重每

分钟 140μg/kg，静脉滴注 6 分钟，总剂量 0.8 mg/kg。

【制剂与规格】腺苷注射液：① 2 ml∶6 mg；② 30 ml ∶ 90 mg（诊断用）。

泛癸利酮（辅酶 Q_{10}）[保（乙）]

Ubidecarenone (Coenzyme Q_{10})

【适应证】可作为充血性心力衰竭、冠心病、高血压、心律失常，原发性、继发性醛固酮增多症、颈部外伤后遗症、脑血管障碍、失血性休克及肝炎等的辅助治疗药物。

【注意事项】静脉注射宜缓慢，以免引起头晕、头胀、胸闷及低血压等。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】可出现恶心、胃部不适、食欲缺乏，但不必停药。偶见荨麻疹及一过性心悸。

【用法与用量】肌内或静脉注射：一次 5 ~ 10 mg，一日 1 次。2 ~ 4 周为 1 个疗程。

【制剂与规格】泛癸利酮注射液：2 ml ∶ 5 mg。

4.3 高血压用药

4.3.1 高血压及其药物治疗

高血压（hypertention）是以体循环动脉压升高、周围小动脉阻力增高同时伴有不同程度的心排血量和血容量增加为主要表现的临床综合征。临床上可分为原发性及继发性两大类。发病原因不明的称为原发性高血压，又称高血压病。是一种与遗传、环境有关的可导致心、脑、肾及周围血管、眼底等靶器官病理损害并致功能障碍的常见心血管疾病，占总高血压患者的 90% 以上。约有 10% 的高血压患者，其血压的升高是因为本身有明确而独立的病因及疾病所致一种临床表现，称为继发性高血压。

按照 2005 年版中国高血压指南，根据血压水平、相关危险因素、靶器官损害和临床疾病将高血压分为低危、中危、高危和极高危。

· 高血压的诊断标准（表 4-1，表 4-2）：在未用抗高血压药情况下，收缩压 ≥ 140 mmHg 和（或）舒张压 ≥ 90 mmHg。按血压水平将高血压分为 1、2、3 级。收缩压 ≥ 140 mmHg 和舒张压 < 90 mmHg 单列为单纯性收缩期高血压。

4.3.1.1 抗高血压药的分类

按照中国 2005 年高血压指南分为 6 类，即利尿药、β 受体拮抗药、钙通道阻滞药（CCB）、血管紧张素转换酶抑制药（ACEI）、血管紧张素受体 Ⅱ 拮抗药（ARB）和 α 受体拮抗药（2007 年 ESC/ESH 公布的指南中已不将 α 受体拮抗药列为一线治疗高血压药物）。

（1）利尿药：通过利尿排钠，降低容量负荷，改善增高的血压。主要具有降压作用的排钾类利尿药有噻嗪类（如氢氯噻嗪、氯噻嗪）及襻利尿药（如呋塞米、布美他尼、托拉塞米等）；兼有排钾及扩血管作用的利尿药（如吲达帕胺）；以及排钾、保钾双重作用的固定复方制剂（如氢氯噻嗪／阿米洛利）。

表 4-1 血压水平的定义和分类

类　别	收缩压（mmHg）	舒张压（mmHg）
正常血压	< 120	< 80
正常高值	120 ~ 139	80 ~ 89
高血压	≥ 140	≥ 90
1 级高血压（轻度）	140 ~ 159	90 ~ 99
2 级高血压（中度）	160 ~ 179	100 ~ 109
3 级高血压（重度）	≥ 180	≥ 110
单纯收缩期高血压	≥ 140	< 90

若患者的收缩压与舒张压分属不同的级别时，则以较高的分级为准。单纯收缩期高血压也可按照收缩压水平分为 1、2、3 级

表 4-2 高血压危险分层标准

其他危险因素和病史	血压（mmHg）		
	1 级 （轻度高血压） SBP 140 ~ 159 或 DBP 90 ~ 99	2 级 （中度高血压） SBP 160 ~ 179 或 DBP 100 ~ 109	3 级 （重度高血压） SBP ≥ 180 或 DBP ≥ 110
Ⅰ 无其他危险因素	低危	中危	高危
Ⅱ 1 ~ 2 个危险因素	中危	中危	极高危
Ⅲ ≥ 3 个危险因素，或 TOD* 或糖尿病	高危	高危	极高危
Ⅳ ACC*	极高危	极高危	极高危

*TOD．靶器官损害；*ACC．有关的临床情况（包括临床有表现的心血管疾病和肾脏疾病）
根据危险分层决定治疗的手段及治疗的时间

（2）β 受体拮抗药：通过降低心率及交感活性使心排血量降低从而起到降压作用。常用于高血压治疗的 β 受体拮抗药有普萘洛尔、阿替洛尔、美托洛尔、比索洛尔、卡维地洛、阿罗洛尔和拉贝洛尔等。

（3）钙通道阻滞药（CCB）：通过拮抗平滑肌上的 L 型钙离子通道从而发挥扩血管（二氢吡啶类）以及降低心排血量（非二氢吡啶类）的降压作用。二氢吡啶类 CCB 包括硝苯地平、非洛地平、尼群地平、氨氯地平、左氨氯地平、尼卡地平和拉西地平等。非二氢吡啶类具有降压作用的药物有缓释地尔硫䓬和缓释维拉帕米。

（4）血管紧张素转换酶抑制药（ACEI）：通过抑制 ACE 酶使血管紧张素Ⅱ减少，增加缓激肽生成而降压。主要药物有卡托普利、依那普利、贝那普利、雷米普利、福辛普利、赖诺普利、咪哒普利等。

（5）血管紧张素Ⅱ受体拮抗药（ARB）：通过拮抗血管紧张素Ⅱ的 AT_1 受体有可能继而激活 AT_2 受体发挥降压作用。主要药物有氯沙坦、缬沙坦、厄贝沙坦、坎地沙坦、替米沙坦、奥美沙坦等。

（6）α 受体拮抗药：通过拮抗血管平滑肌上的 α_1 受体，使血管扩张而降压。主要药物有多沙唑嗪、特拉唑嗪、哌唑嗪、乌拉地尔、酚苄明、妥拉唑林等。

（7）固定复方制剂：通过不同降压机制药物的小剂量联合起到协同降压、不良反应下降作用。主要药物有复方降压片、复方利血平／氨苯蝶啶片（降压 0 号）、氯沙坦／氢氯噻嗪、缬沙坦／氢氯噻嗪、厄贝沙坦／氢氯噻嗪、培垛普利／吲达帕胺、复方罗布麻等。

4.3.1.2 高血压治疗药物选用原则

（1）抗高血压药物的使用应当针对在有明确高血压或伴有靶器官损害及相关临床疾病的高血压患者。

（2）降压治疗中本着个体化的原则，例如以容量增高为主的高血压或老年人以 CCB 和利尿药作为优先初始治疗，交感活性增高无代谢综合征的患者以 β 受体拮抗药作为初始治疗，有肾素 - 血管紧张素 - 醛固酮系统（RAAS）激活或有蛋白尿的高血压患者以 ACEI 或 ARB 作为基础治疗。

（3）高血压的治疗要本着时间治疗学原则，对非杓型（夜间高负荷血压）以及凌晨血压增高的患者可以选择长效、控释剂型抗高血压药物或改变服药时间，以保证全天的血压控制。

（4）高血压分层治疗

①低危和中危组：患者通常无临床症状，常规以生活方式干预为主导治疗，当无效时可考虑药物治疗。如有代谢综合征可考虑首选 ACEI 或 ARB。如无代谢综合征，但有心率偏快，可使用β受体拮抗药。

②高危和极高危组：无危险因素但血压水平在 3 级（> 180/110 mmHg）或有 1 ~ 2 个危险因素而血压水平在 2 级（160 ~ 179/100 ~ 109 mmHg），通常在生活方式的干预基础上采用抗高血压药物治疗。治疗原则是要使血压值达标（<

140/90 mmHg)。一般应用 2 种以上药物的联合治疗。也可以应用固定复方制剂。

有心脏靶器官损害（左室肥厚），血压在 1、2 级水平的高危患者，超声心动图显示左室肥厚及左室舒张功能不全；但 LVEF > 50%。通常应用 ACEI 或 ARB 联合非二氢吡啶类的钙通道阻滞药，或在 β 受体拮抗药的基础治疗上联合 CCB 治疗。

有肾脏靶器官损害（蛋白尿或微量白蛋白尿），血压在 1、2 级水平的高危患者，常伴有夜尿增多现象，尿常规或尿蛋白 / 肌酐比异常，或 24 小时尿蛋白排泄异常，eGFR 小于每分钟 60 ml。临床药物治疗以 ACEI 或 ARB 作为基础抗高血压药物，通常采用双倍剂量，在血压没有达标时（> 130/80 mmHg）可联合应用 CCB。

有血管靶器官损害（颈、股等动脉内膜增厚或斑块），血压在 1、2 级水平的高危患者，多数为高龄，血压以收缩压增高、脉压增大为特征。治疗方案以 CCB 联合 ACEI 或 ARB 为首选。

高危和极高危患者需要长期治疗。选择依从性好、不良作用小、强效且平稳的药物 [长效、高谷 / 峰（T/P）比值、高平滑指数] 尽可能减少血压的波动，避免增加不良的代谢异常，以达到较好的改善靶器官损害，延缓疾病的进展，降低心血管发生和死亡的风险。

（5）联合用药的原则：根据中国 2005 年高血压指南、2007 年 ESC/ESH 指南及美国 JNC7 指南，在以下情况下需要联合治疗。① 2 级以上高血压（≥ 160/100 mmHg，无危险因素及相关疾病）。②高危以上高血压患者（有 3 个以上危险因素及有靶器官损害和有相关心血管疾病）。③单药治疗血压仍未达标者。

联合降压有 2 种方式。第一种是固定复方制剂的联合。它具有使用方便，临床依从性好的特点，但存在调节剂量不方便的缺点。新型 2 种药物的固定复方制剂有氯沙坦氢氯噻嗪、厄贝沙坦氢氯噻嗪、缬沙坦氢氯噻嗪等。我国传统的多种药物组合的固定复方制剂，如复方利血平氨苯蝶啶片、复方降压片、珍菊降压片等，也可用于单药控制不良的高血压。第二种是药物临时组合的联合。它具有可根据疾病的和血压的程度调整剂量和品种特点，主张的联合是以联合机制协同、不良反应减少为原则。具体药物联合方案为 ACEI/ARB + 噻嗪类利尿药；CCB + ACEI/ARB；CCB + 噻嗪类利尿药；CCB + β 受体拮抗药。

4.3.1.3　特殊情况的处理

（1）老年高血压：降压治疗对 80 岁以上的高龄老年高血压也是有益的。单纯收缩期高血压，小剂量利尿药或 CCB 是有效的，必要时可加 ACEI/ARB。降压治疗时注意直立性低血压的发生。对于年龄 > 65 岁以上的老年人，收缩压降至 140 mmHg 以下是困难的，因此建议收缩压目标为 < 150 mmHg。

（2）高血压并发糖尿病：糖尿病的血压目标 < 130/80 mmHg，首选 ACEI 或 ARB，往往需要联合治疗，必要时加 CCB 或利尿药。

（3）高血压肾脏病：血压目标为 < 130/80 mmHg，首选 ACEI 或 ARB，必要时加 CCB 或襻利尿药。

（4）高血压合并妊娠：选用硫酸镁、甲基多巴降压治疗是安全的，二氢吡啶类 CCB，β 受体拮抗药也是有效的。肼屈嗪静脉用药可用于高血压危象。

（5）高血压危象（hypertensive crisis）：按照 2005 年中国高血压指南，高血压危象包括高血压急症和高血压亚急症。高血压急症（hypertensive emergency）的特点为血压严重升高（> 180/120 mmHg）并伴发进行性靶器官功能不全的表现，包括高血压脑病、颅内出血、急性心肌梗死、急性左室衰竭伴肺水肿、不稳定型心绞痛、主动脉夹层。高血压急症需立即进行降压治疗以阻止靶器官进一步损害。高血压亚急症（hypertensive urgency）是高血压严重升高但不伴靶器官损害。

高血压危象治疗原则：①持续监测血压和尽快应用适合的抗高血压药，通常应采用静脉药物，如 α 受体拮抗药乌拉地尔静脉制剂，有心力衰竭症状者可采用硝普钠静脉制剂治疗，老年人或有冠心病的患者可考虑首选硝酸酯类静脉制剂。②控制

血压降低的速度，尽可能不要降得过快、过低，避免患者出现不耐受的症状。第一小时血压下降约25%。在以后的2～6小时血压降至160/100～110 mmHg。在24～48小时逐渐降至原血压水平。③降压的幅度可维持在1级高血压水平（140～159/90～99 mmHg)。④对急性缺血性卒中，没有明确的临床试验证据要求立即抗高血压治疗；主动脉夹层应将收缩压迅速降至100 mmHg左右（如能耐受)。

4.3.2 钙通道阻滞药

见4.8。

4.3.3 肾素-血管紧张素-醛固酮系统药

见4.9。

4.3.4 β肾上腺素受体拮抗药

见4.7。

4.3.5 血管舒张性抗高血压药

硝普钠[基(基)，保(甲)]

Nitroprusside

【适应证】高血压急症（高血压危象、高血压脑病、恶性高血压、嗜铬细胞瘤手术前后阵发性高血压、外科麻醉期间进行控制性降压)，急性心力衰竭，急性肺水肿。

【注意事项】(1) 肾功能不全而本品应用超过48～72小时者，每日须测定血浆中氰化物或硫氰酸盐，保持硫氰酸盐不超过100μg/ml；氰化物不超过3μmol/ml。(2) 下列情况慎用，如脑血管或冠状动脉供血不足；麻醉中控制性降压时，应先纠正贫血或低血容量；脑病或其他颅内压增高；肝、肾功能不全；甲状腺功能过低；肺功能不全；维生素B_{12}缺乏。(3) 老年人用本品须注意增龄时肾功能减退对本品排泄的影响，老年人对降压反应也比较敏感，故用量宜酌减。(4) 本品不可静脉注射，应缓慢静脉注射或使用微量输液泵。(5) 在用药期间，应经常监测血压，急性心肌梗死患者使用本品时须监测肺动脉舒张压或楔压。(6) 药液有局部刺激性，谨防外渗。(7) 如静脉滴注已达每分钟10μg/kg，经10分钟降压仍不满意，应考虑停用本品。(8) 左心衰竭伴低血压时，应用本品须同时加用心肌正性肌力药如多巴胺或多巴酚丁胺。(9) 偶尔出现耐药性，视为氰化物中毒先兆，减慢滴速即可消失。

【禁忌证】对本品成分过敏者、代偿性高血压（如动静脉分流或主动脉缩窄)、孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】血压降低过快过剧时可出现眩晕、大汗、头痛、肌肉颤搐、神经紧张、焦虑、烦躁、胃痛、反射性心动过速、心律失常、症状的发生与静脉给药速度有关；硫氰酸盐中毒或逾量时，可出现运动失调、视物模糊、谵妄、眩晕、头痛、意识丧失、恶心、呕吐、耳鸣、气短；皮肤出现光敏感、皮肤石板蓝样色素沉着、过敏性皮疹、氰化物中毒或超量时、可出现反射消失、昏迷、心音遥远、低血压、脉搏消失、皮肤粉红色、呼吸浅、瞳孔散大。

【用法与用量】用前将本品50 mg溶解于5%葡萄糖注射液5 ml中，再稀释于250～1 000 ml 5%葡萄糖注射液中，在避光输液瓶中静脉滴注。溶液的保存与应用不应超过24小时。溶液内不宜加入其他药品。静脉滴注：成人开始按体重每分钟0.5μg/kg。根据治疗反应以每分钟0.5μg/kg递增，逐渐调整剂量，常用剂量为每分钟3μg/kg，极量为每分钟10μg/kg，总量为3 500μg/kg。儿童常用量按体重每分钟1.4μg/kg，按效应逐渐调整用量。

【制剂与规格】注射用硝普钠：50 mg。

二氮嗪[保(乙)]

Diazoxide

【适应证】用于恶性高血压、高血压危象、幼儿特发性低血糖症、胰岛细胞瘤引起的严重低血糖。

【注意事项】(1) 对噻嗪类利尿药、襻利尿药、碳酸酐酶抑制药等过敏者，对本品也可能过敏。(2) 下列情况慎用，如急性主动脉夹层、心肌梗死、代偿性高血压、冠状动脉或脑动脉供血不足、痛风、低钾血症、肝功能不全患者。(3) 儿童不宜久用。(4) 老年人应减量使用。(5) 对单胺氧化酶抑制药和嗜铬细胞瘤引起的高血压无效。(6) 不宜与噻嗪类利尿药合用。

(7) 可加剧高血糖和高尿酸血症。(8) 注射时防止漏出血管外，以免引起疼痛和炎症。(9) 氮嗪注射液不宜与其他药物及输液配伍。

【禁忌证】对本品成分过敏者、充血性心力衰竭、糖尿病、孕妇及哺乳期妇女、肾功能不全的重型高血压。

【不良反应】水钠潴留，水肿，尿量减少；少见血糖过高，心律失常，低血压，胸闷，神志模糊，发热，皮疹，出血，手麻；眩晕或头晕；味觉改变，便秘，胃肠道反应；背痛，脸潮红，头痛，乏力，耳鸣，注射部位静脉发热和疼痛；肝肾功能损害，水、电解质紊乱。

【用法与用量】(1) 静脉注射：成人一次 150 mg，或按体重一次 1 ~ 3 mg/kg，严重高血压隔 5 ~ 15 分钟后重复注射 1 次，已达疗效出现，此后按需要每 4 ~ 24 小时 1 次，直到随后所用口服抗高血压药发生作用，此过程一般需 4 ~ 5 日。极量一日 1.2 g。儿童按体重一次 1 ~ 3 mg/kg，用法同成人。(2) 快速静脉注射：成人一次 200 ~ 400 mg，在 15 ~ 20 秒注完。抢救高血压危象时，可在 0.5 ~ 3 小时再注射 1 次，1 日总量不超过 1 200 mg。儿童按体重一次 5 mg/kg。病人卧位快速静脉注射。症状缓解后再改以口服降压药维持。

【制剂与规格】二氮嗪注射液：① 10 ml : 0.15 g；② 20 ml : 0.3 g。

肼屈嗪 [保(乙)]

Hydralazine

【适应证】用于高血压、心力衰竭。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 合并冠心病患者慎用。(3) 老年人对本品的降压作用较敏感，并易有肾功能减退，故宜减少剂量。(4) 对中度原发性高血压，肼屈嗪合并应用利尿药和 β 受体拮抗药则可以获得良好疗效，但本药不宜单独应用。(5) 动物实验中发现本品大剂量有致肿瘤作用，已有的研究未发现本品的致突变作用。(6) 用药期间随访检查抗核抗体、血常规，必要时查红斑狼疮。(7) 长期给药可产生血容量增大、液体潴留，反射性交感兴奋而心率加快、心排血量增加，使本品的降压作用减弱。(8) 缓慢增加剂量或合用 β 受体拮抗药可使不良反应减少。(9) 停用本品须缓慢减量，以免血压突然升高。(10) 食物可增加其生物利用度，故宜在餐后服用。

【禁忌证】对本品成分过敏者，主动脉瘤，脑卒中，严重肾功能不全。

【不良反应】常见头痛，恶心，呕吐，腹泻，心悸，心动过速；少见便秘，低血压，脸潮红，流泪，鼻塞；罕见免疫变态反应，长期大量应用（一日 400 mg 以上），可见皮疹，瘙痒，胸痛，淋巴结肿大，周围神经炎，水肿，红斑狼疮综合征。

【用法与用量】口服：①成人一次 10 mg，一日 4 次，餐后服用。2 ~ 4 日后，加至一次 25 mg，一日 4 次，共 1 周；第 2 周后增至一次 50 mg，一日 4 次。最大剂量不超过一日 300 mg。②儿童按体重一次 0.75 mg/kg，一日 2 ~ 4 次，1 ~ 4 周内渐增至最大量，一日 7.5 mg/kg 或一日 300 mg。

【制剂与规格】盐酸肼屈嗪片：① 10 mg；② 25 mg；③ 50 mg。

米诺地尔 [保(乙)]

Minoxidil

【适应证】用于高血压（第二或第三线用药）。

【注意事项】(1) 老年人对降压作用敏感，通常肾功能较差，口服应用本品应减量，使用溶液时应谨慎。(2) 下列情况慎用，如脑血管病、非高血压所致的心力衰竭、冠心病、心绞痛、心肌梗死、心包积液、嗜铬细胞瘤、肾功能不全，孕妇及哺乳期妇女。(3) 使用本品治疗初期血尿素氮及肌酐增高，但继续治疗后下降至用药前水平；血浆肾素活性、血清碱性磷酸酶、血钠可能增高；血细胞计数及血红蛋白可能因血液稀释而减低。(4) 应用本品期间应定时测量血压、体重。(5) 突然停药可致血压反跳，故宜逐渐撤药。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见心率加快、心律失常、皮肤潮红、水钠潴留、体重增加、下肢水肿、毛发增生；较少见心绞痛、胸痛、头痛；少见过敏反应、皮疹、瘙痒。

【用法与用量】口服：①成人，初始一次 2.5 mg，一日 2 次，以后每 3 日将剂量加倍，逐渐增至出现疗效，维持量一日 10 ~ 40 mg，单次或分次服用。最多一日不能超过 100 mg。②儿童，初始按体重一次 0.2 mg/kg，一日 1 次。以后每 3 日调整剂量，一日 2 次按体重增加 0.1 mg/kg，12 岁以下一日最多 50 mg。维持量一日 0.25 ~ 1 mg/kg，单次或分次服用。

【制剂与规格】米诺地尔片：2.5 mg。

地巴唑 [保(乙)]

Bendazol

【适应证】轻度高血压，脑血管痉挛，胃肠平滑肌痉挛，脊髓灰质炎后遗症，外周颜面神经麻痹，妊娠高血压综合征。

【禁忌证】血管硬化症患者。

【不良反应】大剂量时可引起多汗，面部潮红，轻度头痛，头晕，恶心，血压下降。

【用法与用量】口服：①用于高血压、胃肠痉挛，一次 10 ~ 20 mg，一日 3 次。②用于神经疾病，一次 5 ~ 10 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】地巴唑片：① 10 mg；② 20 mg。

4.3.6 α 受体拮抗药

特拉唑嗪 [基(基)，保(甲)] 用于轻度或中度高血压。初始剂量，一次 1 mg，1 ~ 2 周后一日单剂量可加倍以达到预期效果。维持剂量，一次 2 ~ 10 mg，一日 1 次，睡前服。用于良性前列腺增生，常用维持剂量为一次 5 ~ 10 mg，一日 1 次。（其他见 8.11.1）

乌拉地尔 [保(乙)]

Urapidil

【适应证】各种类型高血压，重症高血压，高血压危象，难治性高血压，控制围手术期高血压。

【注意事项】(1) 肝功能不全者应慎用。(2) 孕妇仅在绝对必要的情况下方可使用本品。(3)老年人慎用，初始剂量宜小。(4) 如果联合其他降压药使用本品前，应间隔一定的时间，必要时调整本药的剂量。(5) 血压骤然下降可能引起心动过缓甚至心脏停搏，治疗期限一般不超过 7 日。(6) 对本品过敏有皮肤瘙痒、潮红，有皮疹应停药。(7) 可能影响其驾驶或机械的操纵能力。(8) 过量可致低血压，可抬高下肢及增加血容量，必要时加升压药。(9) 针剂应静脉注射或静脉滴注，患者须取卧位。本药针剂不能与碱性液体混合。治疗期限一般不超过 7 日。

【禁忌证】对本品成分过敏，主动脉峡部狭窄或动静脉分流（肾透析时的分流除外），哺乳期妇女。

【不良反应】可见头痛，头晕，恶心，呕吐，出汗，烦躁，乏力，心悸，心律失常，呼吸困难；少见过敏反应（瘙痒，皮肤发红，皮疹等）；罕见血小板计数减少；超量用药可见头晕，直立性低血压，虚脱，疲劳等。

【用法与用量】(1) 口服：缓释制剂，30 ~ 60 mg，一日 2 次，维持剂量一日 30 ~ 180 mg。(2) 注射：①静脉注射，一次 10 ~ 50 mg，监测血压变化，降压效果应在 5 分钟内即可显示。若效果不够满意，可重复用药。②静脉滴注的最大浓度为 4 mg/ml，推荐初始输入速度为每分钟 2 mg，维持剂量速度为平均每小时 9 mg。静脉滴注或用输液泵输入应当在静脉注射后使用，以维持血压稳定。血压下降的程度由前 15 分钟内输入的药物剂量决定，然后用低剂量维持。

【制剂与规格】乌拉地尔缓释片：30 mg。

乌拉地尔缓释胶囊：30 mg。

注射用盐酸乌拉地尔：① 25 mg；② 50 mg。

乌拉地尔注射液：5 ml : 25 mg。

盐酸乌拉地尔注射液：① 5 ml : 25 mg；② 10 ml : 50 mg。

乌拉地尔氯化钠注射液：100 ml，内含乌拉地尔 50 mg、氯化钠 0.9 g。

乌拉地尔葡萄糖注射液：100 ml，内含乌拉地尔 50 mg、葡萄糖 5 g。

哌唑嗪[保(甲)]

Prazosin

【适应证】用于高血压（第二线药）、充血性心力衰竭（严重的难治性患者），也用于麦角胺过量。

【注意事项】(1)肝病患者应减小剂量。(2) 肾功能不全时应减小剂量，起始剂量一次 1 mg，一日 2 次为宜。(3) 可以单独或与其他药物联合应用来控制妊娠期严重高血压。(4) 对哺乳期妇女未见不良反应。(5) 老年人对本品的降压作用敏感，有使老年人发生体温过低的可能；老年人肾功能降低时剂量需减小。(6) 精神病患者、机械性梗阻引起的心力衰竭患者慎用。(7) 剂量必须按个体化原则，以降低血压反应为准。(8) 首次给药及以后加大剂量时，建议应卧床时给药，不做快速起立动作，以免发生直立性低血压反应。(9) 与其他降压药合用时，降压作用加强，较易产生低血压，而水钠潴留可能减轻。合用时应调节剂量以求每一种药物的最小有效剂量。为避免这些不良反应的产生，可将盐酸哌唑嗪减为一次 1 ~ 2 mg，一日 3 次。(10) 治疗心力衰竭时可能出现耐药性，早期是由于降压后反射性交感兴奋，后期是由于水钠潴留。前者可暂停给药或增加剂量，后者则宜暂停给药，改用其他血管扩张药。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】可见直立性低血压引起的晕厥；常见眩晕，头痛，嗜睡，心悸，呕吐，腹泻，便秘，水肿，抑郁，易激动，皮疹。少见腹痛，肝功能损害，感觉异常，幻觉，大小便失禁，手足麻木，阳痿，阴茎持续勃起。不良反应主要在服药初期出现。

【用法与用量】口服：①成人首剂 0.5 mg，睡前顿服，此后一次 0.5 ~ 1 mg，一日 2 ~ 3 次，逐渐按疗效调整为一日 6 ~ 15 mg，分 2 ~ 3 次服。② 7 岁以下儿童，一次 0.25 mg，一日 2 ~ 3 次；7 ~ 12 岁儿童，一次 0.5 mg，一日 2 ~ 3 次，按疗效调整剂量。

【制剂与规格】盐酸哌唑嗪片：① 0.5 mg；② 1 mg；③ 2 mg。

酚苄明[保(乙)]

Phenoxybenzamine

【适应证】用于嗜铬细胞瘤的治疗和术前准备，周围血管痉挛性疾病，休克，前列腺增生引起的尿潴留。

【注意事项】(1) 本品对妊娠的影响尚未做充分研究，对妊娠期妇女只有非常必要时应用。(2) 哺乳期妇女宜停药或者停止哺乳。(3) 下列情况慎用，如脑供血不足、代偿性心力衰竭、冠心病、上呼吸道感染、肾功能不全。(4) 老年人对本品降压作用敏感，易发生低温，肾功能较差，应用本品时需慎重。(5) 用药期间需定时测血压。(6) 动物实验证明，长期口服可引起胃肠道癌。(7) 开始治疗嗜铬细胞瘤时，建议定时测定尿儿茶酚胺及其代谢物，以决定用药量。(8) 反射性心率加速可加用 β 受体拮抗药。(9) 与食物或牛奶同服以减少胃肠道刺激。(10) 酚苄明过量时，不能使用肾上腺素，否则会进一步加剧低血压，这称为肾上腺素的反转效应。(11) 给药须按个体化原则，根据临床反应和尿中儿茶酚胺及其代谢物含量调整剂量。(12) 本药局部刺激性强，不做皮下或肌内给药，可采用静脉用药。

【禁忌证】低血压，心绞痛，心肌梗死，对本品过敏。

【不良反应】常见直立性低血压，鼻塞，口干，瞳孔缩小，反射性心跳加快，胃肠刺激；少见神志模糊，倦怠，头痛，阳痿，嗜睡，偶可引起心绞痛和心肌梗死。

【用法与用量】(1) 口服：成人，开始时一次 10 mg，一日 2 次，隔日增加 10 mg，直至获得预期临床疗效或出现轻微 α 受体阻断的不良反应。维持剂量一次 20 ~ 40 mg，一日 2 次。儿童，开始按体重 0.2 mg/kg，一日 2 次；或按体表面积 6 ~ 10 mg/m^2，一日 1 次。以后每隔 4 日增量 1 次，直至取得疗效。维持量一日按体重 0.4 ~ 1.4 mg/kg 或按体表面积 12 ~ 36 mg/m^2，分 3 ~ 4 次口服。(2) 注射：①静脉注射，按体重一日 0.5 ~ 1 mg/kg；②静脉滴注，用于心力衰竭和休克，0.5 ~ 1 mg/kg，加入 5% 葡萄糖液 200 ~ 500 ml 中稀释后静脉滴注，2 小

时滴完，一日总量不宜超过2mg/kg。嗜铬细胞瘤术前应用3日，必要时麻醉诱导时给药一次。

【制剂与规格】盐酸酚苄明片：① 5mg；② 10 mg。

盐酸酚苄明注射液：1 ml : 10 mg。

酚妥拉明 [基(基)，保(甲)]

Phentolamine

【适应证】控制嗜铬细胞瘤患者可能出现的高血压危象，嗜铬细胞瘤的诊断性检查，预防静脉或静脉外注射去甲肾上腺素后出现的皮肤坏死或腐烂；勃起功能障碍（口服制剂）。

【注意事项】(1) 本品尚缺乏对妊娠妇女的研究，只有在必须使用时，方可在妊娠期使用。(2) 尚不知本品是否经乳汁分泌，但为慎重起见，哺乳期妇女要选择停药或者停止哺乳。(3) 下列情况慎用，如精神病、糖尿病。(4) 老年人应用本品时需慎重。(5) 必须监测血压。(6) 使用本品可影响驾车和机械操作的能力。(7) 由于存在亚硫酸酯，可能导致急性气喘、休克或失去知觉等过敏反应。(8) 可能会发生心肌梗死、脑血管痉挛和脑血管闭塞，通常与明显的低血压有关。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者，已知对亚硫酸酯过敏者。(2) 低血压、心肌梗死或有心肌梗死史者、冠脉功能不全、心绞痛、冠心病、胃炎、消化性溃疡、严重动脉硬化者。(3) 严重肝肾功能不全者。

【不良反应】常见直立性低血压、心动过速、心律失常、鼻塞、恶心、呕吐；少见晕厥、乏力；罕见心绞痛、心肌梗死、神志模糊、头痛、共济失调、言语含糊。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：(1) 嗜铬细胞瘤手术，术时如血压升高。①成人，静脉注射 2 ~ 5 mg 或静脉滴注每分钟 0.5 ~ 1 mg，以防肿瘤手术时出现高血压危象；②儿童，术中血压升高时可静脉注射 1 mg，也可按体重一次 0.1 mg/kg，必要时可重复或持续静脉滴注。(2) 心力衰竭时减轻心脏负荷，静脉滴注每分钟 0.17 ~ 0.4 mg。

【制剂与规格】甲磺酸酚妥拉明注射液：① 1 ml : 5 mg；② 1 ml : 10 mg。

注射用甲磺酸酚妥拉明：10 mg。

多沙唑嗪 用于良性前列腺增生的症状控制、高血压。口服：普通片成人起始剂量一次 1 mg，一日 1 次，1 ~ 2 周后根据临床反应和耐受情况调整剂量；首剂及调整剂量时宜睡前服。维持剂量 1 ~ 8 mg，一日 1 次。控释片一次 4 mg，一日 1 次。不得咀嚼、掰开或碾碎后服用。（其他见 8.11.1）

妥拉唑林（妥拉唑啉）[保(乙)]

Tolazoline

【适应证】用于治疗经给氧或机械呼吸而系统动脉血氧浓度仍达不到理想水平的新生儿持续性肺动脉高压。

【注意事项】(1) 本品主要通过肾脏排泄，肾功能障碍时应减量，肾功能不全或少尿患者，注射时应适当降低维持量（< 每小时 0.9 mg/kg），减慢输液速度。(2) 下列情况慎用，如二尖瓣狭窄、酸中毒、消化性溃疡。(3) 婴儿使用本品后曾有发生低氯性碱中毒、急性肾衰竭和十二指肠穿孔的报道。适当减少剂量能增加使用本品的安全性。婴儿预先使用抗酸药可能会防止胃肠道出血的发生。新生儿不应该使用含有苯甲醇的稀释液。(4) 在用药期间需随访全血细胞计数、动脉血气、血压、心电图、血电解质、胃抽吸物的隐血试验、肾功能包括尿量。(5) 应在婴幼儿监护病房中使用，监护病房应具备受过婴幼儿重症监护专门培训的医护人员及完善的抢救设施。(6) 为理想地控制用量，应使用微量泵。

【禁忌证】缺血性心脏病，低血压，脑血管意外，对本品过敏。

【不良反应】常见胃肠道出血、低氯性碱中毒、体循环低血压、急性肾功能损害；较少见恶心、呕吐、腹泻、上腹痛、麻刺感、寒冷、发抖、出汗、周围血管扩张、皮肤潮红、反射性心动过速；罕见瞳孔扩大。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：用于新生儿肺动脉高压，初始剂量按体重一次 1 ~ 2 mg/kg，10 分钟内静脉注射。可通过头皮静脉或回流至上腔静

脉的其他静脉注射，使本品最大量到达肺动脉。维持剂量每小时0.2 mg/kg，静脉滴注。动脉血气稳定后逐渐减量，必要时在维持输注中可重复初始剂量。负荷量为1 mg/kg。

【制剂与规格】盐酸妥拉唑林注射液：1 ml∶25 mg。

4.3.7 中枢性抗高血压药

可乐定[保(乙)]

Clonidine

【适应证】用于高血压（不作为第一线用药）、高血压急症、偏头痛、绝经期潮热、痛经、阿片类成瘾的戒毒治疗；滴眼液用于青光眼、高眼压症。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女尚无充分研究，仅在必要时使用。(2) 下列情况慎用，如脑血管病、冠状动脉供血不足、精神抑郁史、近期心肌梗死、雷诺病、慢性肾功能不全、窦房结或房室结功能低下、血栓闭塞性脉管炎。(3) 老年人对降压作用较敏感，肾功能随年龄增长降低，应用时须减量，并注意防止直立性低血压。(4) 长期用药由于液体潴留及血容量扩充，可产生耐药性，降压作用减弱，加利尿药可纠正。(5) 停药必须在1～2周逐渐减量，同时加以其他降压治疗以免血压反跳。手术必须停药，应在术前4～6小时停药，术中静滴降压药，术后复用本品。(6) 使用本品可影响驾车和机械操作的能力。

【禁忌证】对本品过敏者、低压性青光眼。

【不良反应】常见口干、倦怠、头痛、眩晕、血管神经性水肿、短暂肝功能异常、便秘等；较少见头晕、性功能减退、直立性低血压、心悸、心动过速、心动过缓、水钠潴留、恶心、呕吐等。罕见烦躁不安、幻视幻听、心力衰竭、心电图异常、短暂血糖升高、血清肌酸激酶升高。

【用法与用量】(1) 口服：①用于高血压：初始剂量一次0.1 mg，一日2次；隔2～4日后可按需一日递增0.2 mg。常用维持剂量为一日0.3～0.9 mg，分2～4次口服。②用于严重高血压紧急治疗：首剂0.2 mg，继以每小时0.1 mg，直至舒张压控制或总量达0.7 mg，后改用维持剂量。(2) 静脉注射：用于降压，常用剂量0.15～0.3 mg，加入葡萄糖注射液20～50 ml缓慢注射，不宜超过一日0.75 mg。

【制剂与规格】盐酸可乐定片：0.1 mg。

盐酸可乐定滴丸：0.075 mg。

可乐定贴片：2 mg。

可乐定控释贴片：2.5 mg。

盐酸可乐定滴眼液：① 0.5 ml∶1.25 mg；② 5ml∶12.5mg。

盐酸可乐定注射液：1m∶0.15 mg。

甲基多巴[保(乙)]

Methyldopa

【适应证】用于高血压。

【注意事项】(1) 本药能通过胎盘屏障，在人体的研究尚不充分，已有的研究显示妊娠期妇女服药后对胎儿没有明显有害的影响，因此在必要的情况下甲基多巴可用于妊娠期妇女。(2) 可分泌人乳，不建议哺乳期服用本药。(3) 下列情况慎用，如嗜铬细胞瘤、冠心病、溶血性贫血、有抑郁病史者、肝肾功能不全。(4) 老年人对降压作用敏感，且肾功能较差，须酌减药量。(5) 用药前和用药过程中应定期检查血常规、Coombs试验和肝功能，若发生溶血性贫血应立即停药，通常贫血很快好转，否则应使用糖皮质激素治疗。该类患者不能再次使用甲基多巴。(6) 须定期检查肝功能，尤其在用药的头2～3个月。发现问题立即停药者体温和肝功能可恢复。该类病人不能再次使用甲基多巴。(7) 服用甲基多巴出现水肿或体重增加的患者，可用利尿药治疗。一旦水肿进行性加重或有心力衰竭迹象应停服本品。(8) 患有严重双侧脑血管病者，若服药过程中发生不自主性舞蹈症，须立即停药。

【禁忌证】活动性肝脏疾病；Coombs试验阳性。

【不良反应】常见下肢水肿、口干、头痛、乏力；较少见药物热、嗜酸性粒细胞增多、肝功能变化、精神改变（抑郁或焦虑、梦呓、失眠）、性功能减退、乳房

增大、恶心、呕吐、腹泻、晕倒等；少见肝功能损害、骨髓抑制、白细胞及血小板减少、溶血性贫血、帕金森病样改变等。

【用法与用量】口服：①成人一次250 mg，一日2～3次。每2日调整剂量一次，至达预期疗效。一般晚上加量以减少药物的过度镇静作用。若与噻嗪类利尿药合用时，初始剂量一日0.5 g，维持剂量一日0.5～2 g，分2～4次服，最大剂量一日＜3 g。用药2～3个月后可产生耐药性，给利尿药可恢复疗效。②儿童按体重一日10 mg/kg，分2～4次服。以后每2日调整剂量一次，至达到疗效。最大剂量一日65 mg/kg或3 g。

【制剂与规格】甲基多巴片：0.25 g。

4.3.8 其他抗高血压药

硫酸镁[基(基)，保(甲)] 用于高血压。（其他见11.5）

利血平[保(甲/乙)]

Reserpine

【适应证】用于高血压，高血压危象。

【注意事项】(1) 本品可通过胎盘屏障，可能引起胎儿呼吸道分泌物增多、鼻充血等，故妊娠期妇女禁用。(2) 本品可由乳汁分泌，可能引起婴儿分泌物增多、鼻充血、青紫、低温、食欲缺乏等，故哺乳期妇女慎用。(3) 下列情况慎用，如过敏患者、体弱和老年患者、帕金森病、癫痫、心律失常、心肌梗死、心脏抑制、呼吸功能不全、消化性溃疡、溃疡性结肠炎、胃肠功能失调、胆石症、高尿酸血症和有痛风病史者、慢性肾功能不全、儿童和老年人。儿童减量慎用。老年人减量慎用。

【禁忌证】对本品及萝芙木制剂过敏；活动性溃疡；溃疡性结肠炎；抑郁症；严重肾功能障碍及孕妇。

【不良反应】大量口服或注射给药易出现不良反应，常见有注意力不集中、倦怠、晕厥、头痛、乏力、神经紧张、抑郁、焦虑、多梦、梦呓、清晨失眠、阳痿、性欲减退、帕金森症等。较常见腹泻、眩晕、口干、食欲减退、恶心、呕吐、鼻塞等，上述不良反应持续出现时须多加注意。较少见便血、呕血、胃痛、心律失常、心动过缓、支气管痉挛、手指强硬颤动等；偶见体液潴留、充血性心力衰竭、皮肤潮红、皮疹、视物模糊等。

【用法与用量】(1) 口服：初始剂量一次0.1～0.25 mg，一日1次，经1～2周调整剂量，最大剂量一次0.5 mg。(2) 肌内注射：高血压危象时首次0.5～1 mg，以后按需要每4～6小时肌内注射0.4～0.6 mg。

【制剂与规格】利血平片：① 0.1 mg；② 0.25 mg。

利血平注射液：① 1 ml : 1 mg；② 1 ml : 2.5 mg。

复方利血平氨苯蝶啶：氢氯噻嗪12.5 mg，氨苯蝶啶12.5 mg，硫酸双肼屈嗪12.5 mg，利血平0.1 mg。

复方降压片：利血平0.032 mg、氢氯噻嗪3.1 mg、维生素B_6 1 mg、混旋泛酸钙1 mg、三硅酸镁30 mg、氯化钾30 mg、维生素B_1 1 mg、硫酸双肼屈嗪4.2 mg、盐酸异丙嗪2.1 mg。

萝芙木全碱

Verticil

【适应证】用于早期高血压。

【注意事项】(1) 本品可以通过胎盘屏障而进入脐带血中，引起胎儿呼吸道分泌增多、鼻充血等，孕妇禁用。(2) 本品可由乳汁分泌，引起婴儿呼吸道分泌物增多、鼻充血、青紫、低温和食欲缺乏，哺乳期妇女应停止哺乳。(3) 下列情况慎用，如心律失常、嗜铬细胞瘤、消化性溃疡、肾功能不全者、癫痫、胆石症、精神抑郁史者、震颤麻痹、溃疡性结肠炎、呼吸功能受损、老年人、体衰者。老年人、体衰者宜用小剂量。(4) 出现下列情况须停药，如球后神经炎、视物模糊、清晨失眠、食欲减退、阳痿、精神抑郁。(5) 在电休克治疗前2周应停用。(6) 本品引起胃肠道动力加强和分泌增多，可使胆石症患者发生胆绞痛。(7) 患者需进行手术时可不停药，但必须告知麻醉医师，事先给予阿托品以防止心动过缓，若血压下降过度，可用肾上腺素纠正。

【禁忌证】对本品过敏者，孕妇及哺

乳期妇女禁用。

【不良反应】可见轻微鼻塞、嗜睡、腹泻等。

【用法与用量】口服：一次 4 ~ 8 mg，一日 3 次。血压稳定后即改为每次 4 mg。

【制剂与规格】萝芙木全碱片：4 mg。

环轮宁[保(乙)]

Cycleanine Dimethobromide

【适应证】麻醉期间控制性降压药。如动脉导管未闭结扎术，脑膜瘤切除术的控制性降压，小儿麻醉期间控制性降压等。

【注意事项】(1) 应在气管插管和进行呼吸管理的情况下应用，这是因为一方面降低血压的情况下需要保证充分的气体交换；另一方面，环轮宁具有一定的非去极化肌肉松弛作用，使用者会出现一定程度的呼吸肌麻痹现象，在无呼吸管理的情况下，应用是不安全的。(2) 降压效果与剂量大小、麻醉深度及用药前的血压水平均存在某种程度的正比关系。使用方法及剂量，宜根据需要降压的时间及手术的要求决定。在患者循环功能良好的情况下，若需时间在 15 分钟左右的低血压，可应用单次给药的方法，其剂量最好以 0.25 mg/kg 静脉注射，作为试验剂量，然后根据患者的反应决定其剂量，原则上单剂量注射不超过 0.5 ~ 1.0 mg/kg。若估计降压的时间在 15 分钟以上者，则用单剂量给药作降压诱导，然后以 0.05% ~ 0.2%的溶液连续静脉滴注以维持预定的降压水平，滴注的浓度和速度应根据患者的血压变化予以调整。必要时还可补以单剂量给药。当然，作为控制降压的措施本身就存在一定的危险性，所以应用时应严格掌握适应证，并且要慎重从事。(3) 使用本品后，若出现血压过低的情况，可静脉注射麻黄碱、间羟胺、多巴胺或 50% 葡萄糖注射液升压。(4) 使本品时，应保证患者在给药前及给药的过程中血容量均应正常，如有失血应予及时补足，否则会出现血压过低情况。

【禁忌证】重症肌无力患者；对本品过敏者。

【不良反应】(1) 本品可致患者心率稍快或稍慢，并使瞳孔略有扩大，在停药后 4 ~ 6 小时可恢复，一般不影响视力。(2) 本品具有一定的非去极化肌肉松弛作用，使用中会影响患者的呼吸。(3) 有少数患者用药后，面部和静脉注射局部呈现潮红现象。

【用法与用量】(1) 静脉注射：成人 0.5~1 mg/kg，小儿 0.8~1.2 mg/kg。静脉注射后 1~4 分钟血压开始下降，2 ~ 5 分钟降至坪值，有效降压时间为 8 ~ 20 分钟，停药后约 5 分钟血压自行回升，8 ~ 20 分钟恢复至原水平。(2) 连续静脉滴注时用 0.05% ~ 0.2%浓度的等渗液，开始时一般为每分钟 30 滴，逐渐加至每分钟 100 滴，最快为每分钟 150 滴。根据降压情况调节用药量和速度。

【制剂与规格】环轮宁注射液：2 ml : 10 mg。

4.4 心肌缺血用药

4.4.1 心绞痛及其药物治疗

心绞痛（angina）是由于冠状动脉粥样硬化，使血管管腔狭窄、痉挛或一过性阻塞，导致心肌急剧、短暂的缺血所出现的临床症状。可分为慢性稳定型心绞痛及不稳定型心绞痛两类。

(1) 慢性稳定型心绞痛（chronic stable angina）：由于冠状动脉粥样硬化致使管腔狭窄，直径减少 > 50% ~ 75% 以上时，体力或精神应激可诱发心肌缺血，引起心绞痛。临床上心绞痛发作的诱因、频度、性质、程度、缓解方式等在数周内无显著变化。其治疗应包括改善预后的药物（阿司匹林、β 受体拮抗药、ACEI 和他汀类药物）和缓解心肌缺血药物。β 受体拮抗药对稳定型心绞痛患者可减少发作、增加运动耐量，无禁忌证者应首选。常用药物如美托洛尔、比索洛尔、阿替洛尔、阿罗洛尔等。急性发作时给予硝酸甘油（一次 0.3 ~ 0.6 mg）或硝酸异山梨酯（一次 5 mg）舌下含服。缓解期可选用缓释或长效硝酸酯类制剂，如单硝酸异山梨酯、硝酸甘油皮肤贴片。β 受体拮抗药常与硝酸酯类合用，可增强疗效。心绞痛控制不满意时可加用钙通道阻滞药，后者还具有解除冠状动脉痉挛的作用，对变

异型心绞痛应首选，常用药物为二氢吡啶类钙通道阻滞药和非二氢吡啶类钙通道阻滞药如维拉帕米、地尔硫䓬等。

(2) 不稳定型心绞痛 (unstable angina)：主要由于冠状动脉粥样硬化斑块纤维帽破裂或斑块内出血、表面血小板聚集，血栓形成或诱发冠状动脉痉挛，导致心肌缺血。其心绞痛发作不一定与劳累相关，可在休息时或睡眠中发作。心绞痛程度重、持续时间较长、硝酸酯类药物缓解作用较弱。重者可出现明显心电图缺血性 ST-T 变化，此类心绞痛在临床上列入"急性冠状动脉综合征"(acute coronary syndrome，ACS) 范畴。急性发作时除给予休息、吸氧、硝酸甘油或硝酸异山梨酯舌下含服外，常采用静脉滴注，以硝酸甘油每分钟 10μg 开始，每 3 ~ 5 分钟可增加 5 ~ 10μg，直至症状缓解，并可维持静滴，但持续时间一般不应超过 48 小时，以免出现对硝酸酯的耐药。对无低血压或禁忌证者，应及早开始应用 β 受体拮抗药。对症状缓解不理想者可加用钙通道阻滞药。在心绞痛发作时伴有 ST 段抬高的患者，钙通道阻滞药应为首选，应避免单独使用 β 受体拮抗药。抗凝及抗血小板聚集治疗极为重要，首选抗凝药为低分子肝素或肝素，抗血小板药阿司匹林与氯吡格雷联用。并尽早开始他汀类药物治疗。

对于药物治疗效果不佳，心绞痛发作时伴有严重心律失常、心力衰竭、血流动力学障碍等患者，应及早采用介入治疗 (PCI) 或冠状动脉搭桥术 (CABG)。

4.4.2 硝酸酯类

硝酸甘油 [基(基)，保(甲/乙)]

Nitroglycerin

【适应证】用于心绞痛的治疗及预防，降低血压，充血性心力衰竭。

【注意事项】(1) 仅当确有必要时方可用于妊娠妇女。(2) 哺乳妇女应谨慎使用。(3) 下列情况慎用，如血容量不足、收缩压低、严重肝肾功能不全。(4) 可使肥厚性梗阻型心肌病引起的心绞痛恶化。(5) 不应突然停止用药，以避免反跳现象。(6) 长期连续用药可产生耐药性。

【禁忌证】对硝酸酯类药过敏者、心肌梗死早期、严重贫血、青光眼、颅内压增高者、肥厚性梗阻型心肌病，禁止与 V 型磷酸二酯酶抑制药 (西地那非) 合用。

【不良反应】可见头痛、眩晕、虚弱、心悸、心动过速、直立性低血压、口干、恶心、呕吐、虚弱、出汗、苍白、虚脱、晕厥、面部潮红、心动过缓、心绞痛加重、药疹和剥脱性皮炎。

【用法与用量】(1) 舌下含服：①片剂，一次 0.25 ~ 0.5 mg，每 5 分钟可重复 1 片，如 15 分钟内总量达 3 片后疼痛持续存在，应立即就医。可在活动前 5 ~ 10 分钟预防性使用。②控释口颊片剂，置于口颊犬齿龈上，一次 1 mg，一日 3 ~ 4 次。效果不佳时，可一次 2.5 mg，一日 3 ~ 4 次。勿置于舌下、咀嚼或吞服，避免睡前使用。③气雾剂，舌下喷雾，一次 0.5 ~ 1mg (1 ~ 2 喷)，效果不佳可在 10 分钟内重复给药。(2) 静脉滴注：5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释。初始剂量每分钟 5μg。降低血压或治疗心力衰竭时，可每 3 ~ 5 分钟以每分钟 5μg 速度增加，在每分钟 20μg 无效时可以每分钟 10μg 递增，以后可每分钟 20μg。(3) 贴片：贴于左前胸皮肤，一次 2.5 mg (1 片)，一日 1 次。

【制剂与规格】硝酸甘油片：0.5 mg。

硝酸甘油控释口颊片：①1 mg；②2.5 mg。

硝酸甘油气雾剂：200 揿(每喷 0.5 mg)，14 g : 0.1 g。

硝酸甘油注射液：① 1 ml : 1 mg；② 1 ml : 2 mg；③ 1 ml : 5 mg；④ 10 ml : 10 mg。

硝酸甘油氯化钠注射液：① 100 ml : 10 mg，氯化钠 0.9 g；② 100 ml : 20 mg，氯化钠 0.9 g。

硝酸甘油葡萄糖注射液：① 100 ml : 10 mg，葡萄糖 5 g；② 100 ml : 20 mg，葡萄糖 5 g。

硝酸甘油贴片：25 mg。

亚硝酸异戊酯 [保(甲)]

Amyl Nitrite

【适应证】用于氰化物中毒、心绞痛急性发作。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如老年人、心血管疾病者。(2) 有易燃性，不可近火。(3) 接触可导致接触性皮炎。

【禁忌证】青光眼、脑外伤、脑出血者。

【不良反应】可见面部潮红、头痛、头晕、恶心、呕吐、低血压、不安、心动过速。

【用法与用量】吸入：安瓿包在一层手帕或纱布内折断，经鼻腔吸入本品，一次 15 秒钟。心绞痛发作，一次 0.2 ml。

【制剂与规格】亚硝酸异戊酯吸入剂：0.2 ml。

硝酸异山梨酯 [基(基)，保(甲/乙)]

Isosorbide Dinitrate

【适应证】冠心病的长期治疗，心绞痛的预防，心肌梗死后持续心绞痛，与洋地黄、利尿药联合用于慢性心力衰竭，肺动脉高压。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见硝酸甘油。

【用法与用量】(1) 口服：片剂。①预防心绞痛一次 5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 3 次，一日总量 10 ~ 30 mg。②缓解症状，舌下含服，一次 5 mg。③治疗心力衰竭一次 5 ~ 20 mg，6 ~ 8 小时 1 次。缓释片、缓释胶囊，一次 20 ~ 40 mg，一日 2 次，需个体化调整剂量。本品不可掰开或嚼服。(2) 喷雾：①气雾剂，舌下喷雾，一次 2.5 mg (4 喷)。喷药时避免吸气，10 秒内不得吞咽。②喷雾剂，舌下喷雾，根据发作程度一次 1.25 ~ 3.75 mg (1 ~ 3 喷)。(3) 注射：常用浓度为 50 μg/ml 或 100 μg/ml，需要限制液体摄入时浓度可为 200 μg/ml。静脉注射或静脉滴注，初始剂量可从每小时 1 ~ 2 mg 开始，根据个体需要进行调整，最大剂量不超过每小时 8 ~ 10 mg。心力衰竭时，有时需要大剂量达每小时 10 mg，个别可至每小时 50 mg。(4) 外用：乳膏剂涂于皮肤，小剂量开始，每格相当硝酸异山梨酯 0.2 g。将乳膏按刻度挤出所需长度，均匀涂布于所给印有刻度的纸上 (即 5 cm × 5 cm)，贴在左胸前区，一日 1 次，必要时 8 小时 1 次，可睡前贴用。

【制剂与规格】硝酸异山梨酯片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

硝酸异山梨酯缓释片：① 20 mg；② 40 mg。

硝酸异山梨酯缓释胶囊：20 mg。

硝酸异山梨酯气雾剂：① 9.1 g : 125 mg；② 12.5 g : 125 mg。每喷 0.625 mg。

硝酸异山梨酯喷雾剂：① 5 ml : 90 mg；② 10 ml : 96.2 mg；③ 10 ml : 180 mg；④ 20 ml : 250 mg。每喷 1.25 mg。

硝酸异山梨酯乳膏：10 g : 1.5 g。

注射用硝酸异山梨酯：① 2.5 mg；② 5 mg；③ 10 mg；④ 20 mg；⑤ 25 mg。

硝酸异山梨酯注射液：① 5 ml : 5 mg；② 10 ml : 10 mg；③ 50 ml : 50 mg。

硝酸异山梨酯氯化钠注射液：① 100 ml : 10 mg，氯化钠 0.9 g；② 200 ml : 20 mg，氯化钠 1.8 g。

硝酸异山梨酯葡萄糖注射液：① 100 ml : 10 mg，葡萄糖 5 g；② 250 ml : 25 mg，葡萄糖 12.5 g。

单硝酸异山梨酯 [保(乙)]

Isosorbide Mononitrate

【适应证】用于冠心病的长期治疗，心绞痛的预防，心肌梗死后持续心绞痛的治疗，与洋地黄、利尿药联合治疗慢性心力衰竭。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见硝酸甘油。

【用法与用量】(1) 口服：片剂、分散片剂、胶囊剂、胶丸剂一次 10 ~ 20 mg，一日 2 ~ 3 次，严重病例可一次 40 mg，一日 2 ~ 3 次。缓释片剂、缓释胶囊剂于晨服，初始剂量一次 50 mg 或 60 mg，一日 1 次，需个体化给药。(2) 静脉注射：注射剂用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液溶解并稀释。初始剂量每小时 1 ~ 2 mg，最大剂量每小时 8 ~ 10 mg，需个体化调整剂量。

【制剂与规格】单硝酸异山梨酯片：① 10 mg；② 20 mg；③ 40 mg。

单硝酸异山梨酯胶囊：① 10 mg；② 20 mg。

单硝酸异山梨酯胶丸：① 10 mg；② 20 mg。

单硝酸异山梨酯缓释片：① 50 mg；② 60 mg。

单硝酸异山梨酯缓释胶囊：50 mg。

注射用单硝酸异山梨酯：① 20mg；② 25mg；③ 50 mg。

单硝酸异山梨酯注射液：① 1ml∶10mg；② 2ml∶20mg；③ 5ml∶20mg；④ 10ml∶20mg；⑤ 2ml∶25mg；⑥5ml∶25mg。

单硝酸异山梨酯葡萄糖注射液：①100ml∶20mg，葡萄糖5g；② 250ml∶20mg，葡萄糖12.5g。

单硝酸异山梨酯氯化钠注射液：①100ml∶20mg，氯化钠0.9g；②200ml∶20mg，氯化钠1.8g；③ 250ml∶20mg，氯化钠2.25g；④ 250ml∶50mg，氯化钠2.25g。

4.4.3 钙通道阻滞药

见4.8。

4.4.4 β肾上腺素受体拮抗药

见4.7。

4.4.5 其他心肌缺血用药

曲美他嗪[保(乙)]

Trimetazidine

【适应证】用于心绞痛发作的预防性治疗，眩晕和耳鸣的辅助性对症治疗。

【注意事项】(1) 本品不能排除致畸的危险，最好避免在妊娠期间服用。(2) 哺乳期妇女在治疗期间应暂停哺乳。(3) 此药不作为心绞痛发作时的对症治疗用药，也不适用于对不稳定型心绞痛或心肌梗死的初始治疗。此药不应用于入院前或入院后最初几日的治疗。心绞痛发作时，对冠状动脉病况应重新评估，并考虑治疗的调整（药物治疗和可能的血运重建）。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】罕见恶心、呕吐、过敏反应。

【用法与用量】口服：一次20mg，一日3次，三餐时服用。

【制剂与规格】盐酸曲美他嗪片：20mg。

环磷腺苷[保(乙)]

Adenosine Cyclophosphate

【适应证】用于心绞痛，心肌梗死，心肌炎及心源性休克，改善风湿性心脏病的心悸、气急、胸闷等症状。

【不良反应】偶见发热和皮疹；大剂量静脉注射（按体重每分钟达0.5mg/kg）时，可引起腹痛、头痛、肌痛、睾丸痛、背痛、四肢无力、恶心、手脚麻木、高热等。

【用法与用量】(1) 肌内注射：一次20mg，溶于氯化钠注射液2ml中，一日2次。(2) 静脉注射：一次20mg，溶于氯化钠注射液20ml中，一日2次。(3) 静脉滴注，一次40mg，溶于250～500ml 5%葡萄糖注射液中，一日2次。冠心病以15日为1个疗程，可连续应用2～3个疗程。

【制剂与规格】注射用环磷腺苷：① 20mg；② 40mg；③ 60mg。

环磷腺苷注射液：① 2ml∶20mg；② 5ml∶40mg。

环磷腺苷葡萄糖注射液：250ml∶40mg，葡萄糖12.5g。

环磷腺苷氯化钠注射液：250ml∶40mg，氯化钠2.25g。

三磷腺苷（三磷酸腺苷）[保(乙)]

Adenosine Triphosphate

【适应证】进行性肌萎缩、脑出血后遗症、心功能不全、心肌疾患及肝炎等的辅助治疗。用于中止阵发性室上性心动过速而转复为窦性心律。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如心肌梗死及脑出血发病期、60岁以上老人、窦性心动过缓者。(2) 静脉注射宜缓慢，以免引起头晕、头胀、胸闷及低血压等。

【禁忌证】对本品过敏，病态窦房结综合征，窦房结功能不全。

【不良反应】暂时性呼吸困难，低血压，头晕，胸闷，咳嗽，呃逆，无力感；偶有过敏性休克、发热；哮喘史者可能诱发哮喘；转复心律时有短暂的心脏停搏，转复后可出现乏力。

【用法与用量】(1) 口服：一次20～40mg，一日3次。用量可根据年龄酌情增减。(2) 肌内注射或静脉注射一次10～

20 mg，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】三磷腺苷二钠片：① 10 mg；② 20 mg。

三磷腺苷二钠胶囊：20 mg。

注射用三磷酸腺苷二钠：① 10 mg；② 20 mg。

三磷腺苷二钠注射液：① 1 ml：10 mg；② 2 ml ：20 mg。

三磷腺苷二钠氯化钠注射液：① 50 ml ：10 mg，氯化钠 0.45 g；② 100 ml ：20 mg，氯化钠 0.9 g。

4.5 血脂调节药

血脂异常通常指血浆中胆固醇（TC）和（或）三酰甘油（TG）升高，俗称高脂血症（hyperlipidemia），实际上高脂血症也泛指包括高低密度脂蛋白、低高密度脂蛋白血症在内的各种血脂异常。血脂异常是心脑血管病发病的危险因素，而许多有关降低胆固醇防治心脑血管病的研究结果表明，降低血浆胆固醇可降低冠心病、脑卒中事件发生的危险性。

4.5.1 血脂异常分类

血脂异常分类主要有三种。

（1）继发性或原发性高脂血症：区分血脂异常是否是继发性意义重大，有继发性病因者应针对病因治疗。

（2）高脂蛋白血症的表型分型法：世界卫生组织（WHO）制定了高脂蛋白血症分型，共分为 6 型，如 Ⅰ、Ⅱ a、Ⅱ b、Ⅲ、Ⅳ和 Ⅴ 型。从实用角度出发，血脂异常可进行简易的临床分型（表 4-3）。

（3）高脂血症的基因分型法：随着分子生物学的迅速发展，人们对高脂血症的认识已逐步深入到基因水平。

4.5.2 调血脂治疗的目标

根据 2007 年中国成人血脂异常防治指南，对血脂异常患者开始调脂治疗的 TC 和 LDL-C 值及其目标值（表 4-4）。

表 4-3 血脂异常的临床分型

分型	TC	TG	HDL-C	相当于 WHO 表型
高胆固醇血症	增高	–	–	Ⅱ a
高三酰甘油血症	–	增高	–	Ⅳ、Ⅰ
混合型高脂血症	增高	增高	–	Ⅱ b、Ⅲ、Ⅳ
低高密度脂蛋白血症	–	–	降低	Ⅴ

表 4-4 血脂异常患者开始调脂治疗的 TC 和 LDL–C 值及其目标值

危险等级	TLC 开始	药物治疗开始	治疗目标值
低危：10 年危险性 < 5%	TC ≥ 6.22 mmol/L (240 mg/dl) LDL-C ≥ 4.14 mmol/L (160 mg/dl)	TC ≥ 6.99 mmol/L (270 mg/dl) LDL-C ≥ 4.92 mmol/L (190 mg/dl)	TC < 6.22 mmol/L (240 mg/dl) LDL-C < 4.14 mmol/L (160 mg/dl)
中危：10 年危险性 5% ~ 10%	TC ≥ 5.18 mmol/L (200 mg/dl) LDL-C ≥ 3.37 mmol/L (130 mg/dl)	TC ≥ 6.22 mmol/L (240 mg/dl) LDL-C ≥ 4.14 mmol/L (160 mg/dl)	TC < 5.18 mmol/L (200 mg/dl) LDL-C < 3.37 mmol/L (130 mg/dl)
高危：CHD 或 CHD 等危症，或 10 年危险性 10% ~ 15%	TC ≥ 4.14 mmol/L (160 mg/dl) LDL-C ≥ 2.59 mmol/L (100 mg/dl)	TC ≥ 4.14 mmol/L (160 mg/dl) LDL-C ≥ 2.59 mmol/L (100 mg/dl)	TC < 4.14 mmol/L (160 mg/dl) LDL-C < 2.59 mmol/L (100 mg/dl)
极高危：ACS 或缺血性心血管病合并 DM	TC ≥ 3.11 mmol/L (120 mg/dl) LDL-C ≥ 2.07 mmol/L (80mg/dl)	TC ≥ 4.14 mmol/L (160 mg/dl) LDL-C ≥ 2.07 mmol/L (80 mg/dl)	TC < 3.11 mmol/L (120 mg/dl) LDL-C < 2.07 mmol/L (80 mg/dl)

由于血脂异常与饮食和生活方式有密切关系，所以饮食治疗和改善生活方式是血脂异常治疗的基础措施。无论是否进行药物调脂治疗都必须坚持控制饮食和改善生活方式。

4.5.3 血脂调节的药物

临床上供选用的调脂药物：①羟甲基戊二酰辅酶A还原酶抑制药（他汀类）；②贝丁酸类（贝丁酸类）；③烟酸类；④其他。

（1）他汀类（Statins）：能显著降低TC、LDL-C和Apo B，也降低TG水平和轻度升高HDL-C。此外，还可能具有抗炎、保护血管内皮功能等作用，这些作用可能与冠心病事件减少有关。

大多数人对他汀类药的耐受性良好，有0.5%～2%的病例发生ALT及AST升高，且呈剂量依赖性。胆汁淤积和活动性肝病被列为使用他汀类药物的禁忌证。他汀类药物可引起肌病，包括肌痛、肌炎和横纹肌溶解。他汀类和贝丁酸类合用可能会增加发生肌病的危险。在启用他汀类药物时，要检测ALT及AST和肌酸激酶（CK），治疗期间定期监测复查。

（2）贝丁酸类亦称苯氧芳酸类：此类药物主要降低血浆TG和提高HDL-C水平，促进胆固醇的逆向转运，并使LDL亚型由小而密颗粒向大而疏松颗粒转变。此类药物的常见不良反应为消化不良、胆石症等，也可引起肝脏血清酶升高和肌病。绝对禁忌证为严重肾病和严重肝病。贝丁酸类单用或与他汀类合用时也可发生肌病，应用时须监测肝酶与肌酶，以策安全。

（3）烟酸类：属B族维生素，当用量超过作为维生素作用的剂量时，可有明显的降脂作用。已知烟酸增加Apo AⅠ和Apo AⅡ的合成。烟酸有速释剂和缓释剂两种，临床主要应用缓释剂型。

（4）其他。①胆酸螯合剂：主要阻碍胆酸的肠肝循环，促进胆酸随大便排出，阻断胆汁酸中胆固醇的重吸收。通过反馈机制刺激肝细胞膜表面的LDL受体，加速血液中LDL清除，结果使血清LDL-C水平降低。此类药物的绝对禁忌证为异常β脂蛋白血症和TG＞4.52 mmol/L（400 mg/dl）；相对禁忌证为TG＞2.26 mmol/L（200 mg/dl）。②胆固醇吸收抑制药：依折麦布（Ezetimibe）口服后有效地抑制胆固醇和植物固醇的吸收，减少胆固醇向肝脏的释放，加速LDL的代谢。其安全性和耐受性良好。最常见的不良反应为头痛和恶心。③普罗布考：此药通过掺入到脂蛋白颗粒中影响脂蛋白代谢，而产生调脂作用。可使血浆TC、LDL-C降低，但也明显降低HDL-C。主要适应于高胆固醇血症，尤其是纯合子型家族性高胆固醇血症。常见的不良反应包括恶心、腹泻、消化不良等；亦可引起嗜酸细胞增多，血清尿酸浓度增高；最严重的不良反应是引起心电图QT间期延长，但极为少见，因此有室性心律失常或心电图QT间期延长者禁用。

4.5.3.1 羟甲基戊二酰辅酶A还原酶抑制药（他汀类）

辛伐他汀［基（基），保（甲／乙）］

Simvastatin

【适应证】用于高脂血症，冠心病和脑卒中的防治。

【注意事项】（1）禁用与活动性肝脏疾病或原因不明的转氨酶升高的患者。（2）轻中度肾功能不全者无须调整剂量；严重肾功能不全者（肌酐清除率＜每分钟30 ml）应慎用，起始剂量应为一日5 mg，并密切监测。（3）以下情况慎用，如大量饮酒者、肝病史患者。（4）已经建立在10～17岁的杂合子家族性高胆固醇血症的儿童中使用本品的安全性。（5）血清ALT及AST升高至正常上限3倍时，须停止本品治疗。（6）对于有弥散性的肌痛、肌软弱及肌酸激酶（CK）升高至大于正常值10倍以上的情况应考虑为肌病，须立即停止本品的治疗。

【禁忌证】对本品过敏，活动性肝脏疾病或无法解释的血清转氨酶持续升高，孕妇和哺乳妇女。

【不良反应】常见恶心、腹泻、皮疹、消化不良、瘙痒、脱发、晕眩；罕见肌痛，胰腺炎，感觉异常，外周神经病变，血清AST显著和持续升高，横纹肌溶解，肝炎，

黄疸，血管神经性水肿，脉管炎，血小板减少症，嗜酸性粒细胞增多，关节痛，光敏感性，发热，潮红，呼吸困难等。

【用法与用量】口服：①高胆固醇血症，初始剂量一次 10～20 mg，晚间顿服。心血管事件高危人群，推荐初始剂量一次 20～40 mg，晚间顿服。调整剂量应间隔 4 周以上。②纯合子家族性高胆固醇血症，推荐一次 40 mg，晚间顿服；或一日 80 mg，分早晨 20 mg、午间 20 mg 和晚间 40 mg 服用。③杂合子家族性高胆固醇血症的儿童（10～17 岁），推荐初始剂量一日 10 mg，晚间顿服。最大剂量为 40 mg，应按个体化调整剂量。

【制剂与规格】辛伐他汀片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

辛伐他汀分散片：10 mg。

辛伐他汀胶囊：5 mg。

辛伐他汀干混悬剂：10 mg。

阿托伐他汀[保（乙）]

Atorvastatin

【适应证】用于高胆固醇血症，冠心病和脑卒中的防治。

【注意事项】(1) 肾功能不全者无须调整剂量。(2) 以下情况慎用，如大量饮酒、肝病史、妊娠及哺乳期妇女。(3) 儿童中使用经验仅限少数严重血脂紊乱者，推荐初始剂量为一日 10 mg，最大剂量可一日 80 mg。尚无对儿童生长发育的安全性资料。(4) 对于有弥漫性的肌痛、肌软弱及肌酸激酶（CK）升高至大于正常值 10 倍以上的情况应考虑为肌病，须立即停止本品的治疗。

【禁忌证】对本品过敏，活动性肝脏疾病及血清 ALT 及 AST 持续超过正常上限 3 倍且原因不明者，肌病，孕期、哺乳期妇女。

【不良反应】常见胃肠道不适（便秘、胃胀气、消化不良、腹痛）、头痛、头晕、感觉异常、失眠、皮疹、瘙痒，视物模糊、味觉障碍；少见厌食、呕吐、血小板减少症、脱发、高糖血症、低糖血症、胰腺炎、外周神经病、阳痿；罕见肝炎、胆汁淤积性黄疸、肌炎、肌痛、横纹肌溶解（表现为肌肉疼痛、乏力、发热、并伴有血肌酸激酶升高、肌红蛋白尿等）。

【用法与用量】口服：①原发性高胆固醇血症和混合型高脂血症，初始剂量一日 10 mg。②杂合子型家族性高胆固醇血症，初始剂量为一次 10 mg，一日 1 次。逐步加量（间隔 4 周）至 40 mg，如仍不满意，可将剂量增加至一次 80 mg，一日 1 次或加用胆酸螯合剂。③纯合子型家族性高胆固醇血症，一次 10～80 mg，一日 1 次。④预防性用于存在冠心病危险因素的患者，一日 10 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】阿托伐他汀钙片：① 10 mg；② 20 mg。

阿托伐他汀钙胶囊：10 mg。

普伐他汀[保（乙）]

Pravastatin

【适应证】用于原发性高胆固醇血症，混合型高脂血症，冠心病和脑卒中的防治。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如重肾损害或既往史者，大量饮酒，肝病史。(2) 18 岁以下患者暂不推荐使用。(3) 血清 ALT 及 AST 高至正常上限 3 倍时，须停止本品治疗。(4) 对于有弥漫性的肌痛、肌软弱及肌酸激酶（CK）升高至大于正常值 10 倍以上的情况应考虑为肌病，须立即停止本品的治疗。

【禁忌证】对本品过敏，活动性肝病，肝功能试验持续升高者，孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】常见腹泻、胀气、眩晕、头痛、恶心、皮疹；少见阳痿、失眠；罕见肌痛、肌炎、横纹肌溶解（肌肉疼痛、发热、乏力，常伴血肌酸磷酸激酶增高）。

【用法与用量】口服：初始剂量一次 10～20 mg，睡前顿服。最大剂量一日 40 mg。

【制剂与规格】普伐他汀钠片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

氟伐他汀[保（乙）]

Fluvastatin

【适应证】用于原发性高胆固醇血症，原发性混合型血脂异常。

【注意事项】(1) 对轻至中度肾功能不全的患者不必调整剂量。(2) 大量饮酒及肝病患者慎用。(3) 18 岁以下患者不

推荐使用本品。(4) 血清 ALT 及 AST 升高至正常上限 3 倍时，须停止本品治疗。(5) 对于有弥漫性的肌痛、肌软弱及肌酸激酶（CK）升高至大于正常值 10 倍以上的情况应考虑为肌病，须立即停止本品的治疗。

【禁忌证】对本品过敏，活动性肝病，持续的不能解释的转氨酶升高，严重肾功能不全，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见腹泻，胀气，眩晕，头痛，恶心，皮疹；少见肌痛，背痛，失眠；其他他汀类药治疗时出现的肌炎和横纹肌溶解在本品较少见。

【用法与用量】口服：一次 20 ~ 40 mg，晚餐时或睡前顿服。剂量可按需要调整，反应不佳者可一次 40 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】氟伐他汀钠片：① 20 mg；② 40 mg。

氟伐他汀钠胶囊：① 20mg；② 40 mg。

瑞舒伐他汀 [保（乙）]

Rosuvastatin

【适应证】用于混合型血脂异常症，原发性高胆固醇血症，纯合子家族性高胆固醇血症。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如肝脏疾病，大量饮酒，本人或家族史中有遗传性肌肉疾病，既往有其他 HMG-CoA 还原酶抑制药或贝丁酸类的肌肉毒性史，年龄＞ 70 岁，同时使用贝丁酸类。(2) 对于有弥散性的肌痛、肌软弱及肌酸激酶（CK）升高至大于正常值 10 倍以上的情况应考虑为肌病，须立即停止本品的治疗。(3) 为了避免严重不良反应的发生，开始治疗时应根据病情，从 5 ~ 10 mg 开始，需要时，可在治疗 4 周后调整剂量至高一级的剂量水平，逐增至 20 ~ 40 mg，不宜开始时直接用 40 mg。(4) 本品的使用应遵循个体化原则。

【禁忌证】对本品过敏，活动性肝病，原因不明的血清 ALT 及 AST 持续升高，血清 ALT 及 AST 升高超过 3 倍的正常值上限；严重肾功能损害的患者（肌酐清除率＜每分钟 30 ml）；肌病患者；同时使用环孢素者。

【不良反应】常见头痛，头晕，便秘，恶心，腹痛，肌痛；少见瘙痒，皮疹，荨麻疹；罕见过敏反应（包括血管神经性水肿），肌病和横纹肌溶解，肝转氨酶升高，关节痛；极罕见多发性神经病，黄疸，肝炎等。

【用法与用量】口服：起始剂量为一次 5 mg，一日 1 次。对于需要更强效地降低 LDL-C 的患者初始剂量可考虑一次 10 mg，一日 1 次。如有必要，可在治疗 4 周后调整剂量。一日最大剂量为 20 mg。

【制剂与规格】瑞舒伐他汀钙片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

瑞舒伐他汀钙胶囊：① 5mg；② 10 mg；③ 20 mg。

洛伐他汀 [保（乙）]

Lovastatin

【适应证】用于高胆固醇血症，混合型高脂血症。

【注意事项】(1) 肝病及肝病史患者慎用。(2) 中度肾功能不全患者不必调整剂量；对于严重肾功能不全的患者（肌酐清除率＜每分钟 30 ml），可适当考虑降低剂量，使用剂量超过一日 10 mg 时应慎重考虑，并小心使用。(3) 大量饮酒者慎用。(4) 儿童长期安全性未确立。(5) 血清 ALT 及 AST 升高至正常上限 3 倍时，须停止本品治疗。(6) 对于有弥漫性的肌痛、肌软弱及肌酸激酶（CK）升高至大于正常值 10 倍以上的情况应考虑为肌病，须立即停止本品的治疗。

【禁忌证】对本品过敏，有活动性肝病患者，不明原因血转氨酶持续升高。妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见胃肠道不适、腹泻、胀气、头痛、皮疹、头晕、视物模糊、味觉障碍；偶见血转氨酶可逆性升高；少见阳痿、失眠；罕见肌炎、肌痛、横纹肌溶解（表现为肌肉疼痛、乏力、发热、并伴有血肌酸磷酸激酶升高、肌红蛋白尿等）。

【用法与用量】口服：成人常用量一次 10 ~ 20 mg，一日 1 次。晚餐时服用。剂量可按需要调整，但最大剂量不超过一日 80 mg。

【制剂与规格】洛伐他汀片：20 mg。

洛伐他汀分散片：20 mg。

洛伐他汀胶囊：① 2 mg；② 4 mg；③ 10 mg；④ 20 mg。

4.5.3.2 贝丁酸类

非诺贝特[保(乙)]

Fenofibrate

【适应证】用于高胆固醇血症（Ⅱa型），内源性高三酰甘油血症，单纯型（Ⅳ）和混合型（Ⅱb和Ⅲ型）。

【注意事项】当ALT、AST升高至正常值3倍以上时，应停止治疗。

【不良反应】常见腹部不适、腹泻、便秘、乏力、头痛，性欲丧失、阳痿、眩晕、失眠、肌炎、肌痛、肌无力、肌病；偶见横纹肌溶解；有使胆石增加的趋向。

【禁忌证】对本品过敏者、肝肾功能不全者、胆囊疾病史、胆石症、原发性胆汁性肝硬化、不明原因的肝功能持续异常、妊娠及哺乳期妇女、儿童。

【用法与用量】口服：①片剂、咀嚼片剂、胶囊剂，一次100 mg，一日3次，维持量一次100 mg，一日1～2次。用餐时服。②微粒化胶囊剂，一次160 mg或200 mg，一日1次。本品不可嚼服。③缓释胶囊剂，一次250 mg，一日1次。本品不可掰开或嚼服。

【制剂与规格】非诺贝特片：100 mg。

非诺贝特咀嚼片：①100 mg；②200 mg。

非诺贝特胶囊：100 mg。

非诺贝特微粒化胶囊：① 100 mg；② 160 mg；③ 200 mg。

非诺贝特缓释胶囊：250 mg。

苯扎贝特[保(乙)]

Bezafibrate

【适应证】用于高三酰甘油血症，高胆固醇血症，混合型高脂血症。

【注意事项】(1) 肌酐清除率在每分钟40～60 ml时，一次400 mg，一日2次；肌酐清除率在每分钟15～40 ml时，一次400 mg，一日或隔日1次；肌酐清除率低于每分钟15ml时，一次400 mg，三日1次。(2) 动物实验显示胚胎毒性，妊娠期妇女不宜使用。(3) 哺乳期妇女不宜使用。(4) 儿童服用本品的疗效及安全性，目前尚无实验研究加以证实，故不宜应用。(5) 如用药后临床上出现胆石症、肝功能显著异常、可疑的肌病的症状（如肌痛、触痛、乏力等）或血肌酸磷酸激酶显著升高，则应停药。

【不良反应】见非诺贝特。

【禁忌证】对本品过敏、胆囊疾病史、胆石症、原发性胆汁性肝硬化、严重肝及肾功能不全者。

【用法与用量】口服：①片剂，一次200～400 mg，一日3次，餐后或与饭同服。维持量一次400 mg，一日2次。②缓释片剂，一次400 mg，一日1次。本品不可掰开或嚼服。

【制剂与规格】苯扎贝特片：200 mg。

苯扎贝特缓释片：400 mg。

吉非贝齐（吉非罗齐）[保(乙)]

Gemfibrozil

【适应证】用于饮食控制、减轻体重无效的Ⅳ、Ⅴ型高脂血症，饮食控制、减轻体重及其他药物治疗无效的Ⅱb型高脂血症。

【注意事项】(1) 用药期间应定期检查，全血象及血小板计数、肝功能试验、血脂、血肌酸磷酸激酶。(2) 治疗3个月后如无效即应停药。(3) 如用药后临床上出现胆石症、肝功能显著异常、可疑的肌病的症状（如肌痛、触痛、乏力等）或血肌酸磷酸激酶显著升高，也应停药。

【不良反应】见非诺贝特。

【禁忌证】对本品过敏、胆囊疾病、胆石症、原发性胆汁性肝硬化、严重肝肾功能不全、妊娠及哺乳期妇女。

【用法与用量】口服：一次0.3～0.6 g，一日2次，早餐及晚餐前30分钟服用。

【制剂与规格】吉非贝齐片：0.15 g。

吉非贝齐胶囊：0.3 g。

4.5.3.3 烟酸类

烟酸[保(乙)]

Nicotinic Acid

【适应证】用于高脂血症的辅助治疗

（除Ⅰ型外），烟酸缺乏病（糙皮病等）及扩张小血管（注射剂）。

【注意事项】（1）肝病史患者应慎用。（2）患有原发高胆固醇血症（Ⅰ或Ⅱ型）的妇女在服用烟酸过程中怀孕，应该停止服用本品。（3）烟酸可经乳汁排泄，哺乳期妇女应停止使用或暂停哺乳。（4）以下情况慎用，如与HMG-CoA还原酶抑制药（他汀类）联合应用、不稳定型心绞痛、心肌梗死急性期、痛风或有痛风倾向。（5）治疗期间应定期监测肝功能和肌酸激酶。（6）患有黄疸性肝炎、肝胆疾病、糖尿病或消化道溃疡的患者，在服用期间应该严格监控肝功能和血糖，以免出现严重不良反应。

【禁忌证】对烟酸过敏、严重的或原因未明的肝功能损害、活动性消化性溃疡、动脉出血、儿童患者。

【不良反应】（1）常见潮红，腹泻，恶心，呕吐，腹痛，瘙痒，皮疹。（2）少见眩晕，头痛，心跳加速，心悸，呼吸急促，出汗，全身皮疹，风疹，皮肤干燥，疼痛，乏力，发冷，外周水肿，实验室指标改变（ALT、AST、碱性磷酸酶、总胆红素、乳酸脱氢酶、淀粉酶、空腹血糖和尿酸水平升高，血小板数量减少、凝血酶原时间延长、磷含量降低、肌酸磷酸激酶升高）。（3）罕见葡萄糖耐量下降，失眠，精神紧张，晕厥，感觉异常，视觉紊乱，低血压，直立性低血压，鼻炎，面部水肿，疱疹，斑丘疹，腿部痉挛，肌肉异常，肌痛及肌无力，胸痛。（4）非常罕见过敏反应，食欲缺乏，痛风，偏头痛，眼部异常（中毒性视弱，囊性斑点状水肿），心脏异常（心房颤动、其他心率失常），虚脱，胃肠异常（胃溃疡激活、胃溃疡），黄疸（皮肤和眼睛发黄），色素沉着过度，黑棘皮病。

【用法与用量】（1）口服：高脂血症。普通片初始剂量，一次0.1 g，一日3次，4～7日后可增至一次1～2 g，一日3次。缓释片睡前服用，第1～4周，一次0.5 g，一日1次；第5～8周，一次1 000 mg，一日1次。8周后，根据疗效和耐受性调整剂量，维持剂量，一日1～2 g，最大剂量一日2 g。（2）注射：成人，肌内注射，一次50～100 mg，一日5次；静脉缓慢注射，一次25～100 mg，一日2次或多次。儿童，静脉缓慢注射，一次25～100 mg，一日2次。

【制剂与规格】烟酸片：① 50 mg；② 100 mg。

烟酸缓释片：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 0.75 g。

烟酸缓释胶囊：0.25 g。

烟酸注射液：① 2 ml∶20 mg；② 2 ml∶100 mg；③ 5 ml∶50 mg。

注射用烟酸：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

阿昔莫司[保（乙）]

Acipimox

【适应证】用于高三酰甘油血症（Ⅳ型高脂蛋白血症）、高胆固醇血症（Ⅱa型）、高三酰甘油和高胆固醇血症（Ⅱb、Ⅲ及Ⅴ型）。

【注意事项】（1）肾功能不全时，应根据肌酐清除率调整剂量，肌酐清除率每分钟80～40 ml，一日0.25 g；每分钟40～20 ml，隔日0.25 g。（2）长期应用者，应定期检查血脂及肝肾功能。（3）偶有皮肤潮红及瘙痒，尤其在刚开始服药时，但继续用药，此现象会很快消失。

【禁忌证】对本药过敏、消化性溃疡、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见面部潮红；少见头痛；偶见恶心、呕吐、胃部不适、腹痛、腹泻；极少数发生过敏反应，皮疹、荨麻疹、哮喘、低血压。

【用法与用量】口服：一次250 mg，一日2～3次，餐后服用。根据TG及TC水平调整剂量，一日总剂量不超过1 200 mg。Ⅳ型高脂血症，一次0.25 g，一日2次；Ⅱb、Ⅲ及Ⅴ型高脂血症，一次0.25 g，一日3次。根据血中三酰甘油及胆固醇水平调整剂量，一日总量不超过1.2 g，餐后服用。

【制剂与规格】阿昔莫司胶囊：0.25 g。

维生素E烟酸酯

Vitamin E Nicotinate

【适应证】用于高脂血症，防治动脉粥样硬化。

【注意事项】以下情况慎用，如动脉出血、糖尿病、青光眼、痛风、高尿酸血症、肝病、溃疡病、低血压、肝功能不全。

【不良反应】颈、面部感觉温热，皮肤发红，头痛等，严重皮肤潮红，瘙痒，胃肠道不适。

【用法与用量】口服：一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 3 次。

【制剂与规格】维生素 E 烟酸酯胶囊：0.1 g。

维生素 E 烟酸酯胶丸：0.1 g。

4.5.3.4 其他类

普罗布考[保(乙)]

Probucol

【适应证】用于高胆固醇血症。

【注意事项】(1) 肾功能不全时需减量。(2) 孕妇哺乳期妇女慎用。(3) 儿童不宜服用。(4) 服用本品对诊断有干扰，如可使血转氨酶、胆红素、肌酸磷酸激酶、尿酸、尿素氮短暂升高。(5) 服用本品期间应定期检查心电图 QT 间期。(6) 服用三环类抗抑郁药、抗心律失常药和吩噻嗪类药物的患者，服用本品发生心律失常的危险性大。

【禁忌证】对本品过敏、近期心肌损害（如心肌梗死）、严重室性心律失常、心源性晕厥或不明原因晕厥、QT 间期延长或正在使用延长 QT 间期的药物、血钾或血镁过低者。

【不良反应】常见腹泻，胀气，腹痛，恶心，呕吐；少见头痛，头晕，感觉异常，失眠，耳鸣，皮疹，皮肤瘙痒等；罕见心电图 QT 间期延长，室性心动过速，血小板减少；有发生血管神经性水肿的报道。

【用法与用量】口服：一次 0.5 g，一日 2 次，早、晚餐时服用。

【制剂与规格】普罗布考片：① 0.125 g；② 0.25 g。

依折麦布

Ezetimibe

【适应证】用于原发性高胆固醇血症、纯合子家族性高胆固醇血症、纯合子谷甾醇血症。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。应权衡利弊后决定是否使用。(2) 10 岁以下儿童不推荐应用。

【禁忌证】对本品过敏者；活动性肝病或不明原因的血清 ALT 及 AST 持续升高的患者。

【不良反应】单独应用本品常见头痛、腹痛、腹泻；他汀类联合应用常见头痛、乏力、腹痛、便秘、腹泻、腹胀、恶心、ALT 升高、AST 升高、肌痛。

【用法与用量】口服：成人剂量，一次 10 mg，一日 1 次。可单独服用或与他汀类、贝丁酸类联合应用，本品可在一日之内任何时间服用，可空腹或与食物同时服用。

【制剂与规格】依折麦布片：10 mg。

烟酸肌醇酯[保(乙)]

Inositol Nicotinate

【适应证】用于高脂血症、动脉粥样硬化、各种末梢血管障碍性疾病（如闭塞性动脉硬化症、肢端动脉痉挛症、冻伤、血管性偏头痛等）的辅助治疗。

【注意事项】胃酸缺乏者应同时服用稀盐酸或柠檬汁以减少不良反应。

【禁忌证】(1) 对本品或其他烟酸类药物过敏者禁用。(2) 患活动性肝病、不明原因 ALT、AST 升高等肝功能异常者禁用。(3) 活动性溃疡病、有出血倾向者禁用。

【不良反应】可有轻度恶心、发汗、瘙痒感等反应。

【用法与用量】口服：一次 0.2 ~ 0.6 g，一日 3 次，连续服用 1 ~ 3 个月。

【制剂与规格】烟酸肌醇酯片：0.2 g。

4.6 利尿药

利尿药（diuretic drug）是指能增加尿液生成率的药物，多数利尿药作用于肾单位。根据药物作用的肾单位不同部位，临床常用的利尿药可分为：①作用于近曲小管，主要为碳酸酐酶抑制药、渗透性利尿药。②作用于髓质稀释段，主要为髓襻利尿药。③作用于皮质稀释段，主要为噻嗪类利尿药。④作用于远曲小管，主要为

保钾利尿药。

碳酸酐酶抑制药的常用药物有乙酰唑胺，此类药物可增加钠、钾、碳酸根离子的排出，但利尿作用较弱，临床一般用于眼科疾病，如青光眼降低眼压。

渗透性利尿药的常用药物有甘露醇、山梨醇，此类药物可增加钙、镁、钾、磷酸盐及碳酸氢盐的排出，临床一般用于治疗脑水肿，降低颅内压。

髓袢利尿药的常用药物有呋塞米、布美他尼、托拉塞米等，此类药物利尿作用强，同时有较强的排钾作用。临床上用于治疗水肿，特别是用于急性心力衰竭、急性肾衰竭、慢性肾衰竭、肝硬化腹水等。

噻嗪类利尿药是目前应用最广的利尿药，常用药物有氢氯噻嗪等。吲达帕胺的作用部位亦与噻嗪类相似。此类药物利尿作用中等，在增加排钠、氯的同时也增加排钾。临床上用于治疗各种类型的水肿、尿崩症，也作为一类抗高血压药广泛使用。

保钾类利尿药的常用药物有螺内酯、氨苯蝶啶、阿米洛利等。此类药物利尿作用较弱，利尿同时可增加钠、氯的排出而减少钾的排出。临床上常用于治疗水肿、心力衰竭、肝硬化腹水，也常与排钾利尿药合用，增加利尿效果，减少低钾血症。

4.6.1 噻嗪类利尿药

氢氯噻嗪[基(基)，保(甲)]

Hydrochlorothiazide

【适应证】用于水肿性疾病、高血压、中枢性或肾性尿崩症、肾石症（预防含钙盐成分形成的结石）。

【注意事项】(1) 与磺胺类药物、呋塞米、布美他尼、碳酸酐酶抑制药有交叉过敏反应。(2) 无尿或严重肾功能减退者大剂量可致药物蓄积。(3) 严重肝功能损害者，水、电解质紊乱可诱发肝性脑病。(4) 本品能通过胎盘屏障，对妊娠高血压综合征无预防作用，妊娠期妇女慎用。(5) 以下情况慎用，如糖尿病，高尿酸血症或痛风，高钙血症，低钠血症，红斑狼疮，胰腺炎，交感神经切除者，婴儿黄疸，哺乳期妇女。(6) 老年人应用本类药物较易发生低血压、电解质紊乱和肾功能损害。(7) 在用药期间，应定期检查血电解质、血糖、血尿酸、血肌酶、尿素氮和血压。(8) 应从最小有效剂量开始用药，以减少不良反应的发生，减少反射性肾素和醛固酮分泌。(9) 有低钾血症倾向的患者，应酌情补钾或与补钾利尿药合用。

【禁忌证】对磺酰胺类、噻嗪类药物过敏者。

【不良反应】低钾血症，低氯性碱中毒，低氯低钾性碱中毒，低钠血症，及上述水、电解质紊乱导致的口干、烦渴、肌肉痉挛、恶心、呕吐和极度疲乏无力；高糖血症，高尿酸血症；少见过敏反应（皮疹、荨麻疹），血白细胞减少或缺乏症、血小板减少性紫癜；罕见胆囊炎、胰腺炎、性功能减退、光敏感、色觉障碍。

【用法与用量】口服：(1) 成人，水肿性疾病，一次 50 mg，一日 1 ~ 2 次，或隔日治疗，或一周连服 3 ~ 5 日；高血压，一日 25 ~ 100 mg，分 1 ~ 2 次服用，并按降压效果调整剂量。(2) 儿童，按体重一日 1 ~ 2 mg/kg 或按体表面积一日 30 ~ 60 mg/m^2，分 1 ~ 2 次服，并按疗效调整剂量；< 6 个月的婴儿剂量可达一日 3 mg/kg。

【制剂与规格】氢氯噻嗪片：① 6.25 mg；② 10 mg；③ 25 mg；④ 50 mg。

氯噻酮

Chlortalidone

【适应证】用于水肿性疾病（充血性心力衰竭、肝硬化腹水、肾病综合征、急慢性肾炎水肿、慢性肾衰竭早期），高血压，中枢性或肾性尿崩症，肾石症的预防。

【注意事项】(1) 一日用药 1 次时，应在早晨用药，以免夜间排尿次数增加，间歇用药（非明日用药）能减少电解质紊乱发生的机会。(2) 下列情况慎用，如无尿或严重肾功能减退，糖尿病，高尿酸血症或有痛风病史，严重肝功能损害，高钙血症，低钠血症，红斑狼疮，胰腺炎，交感神经切除者，有黄疸的婴儿。(3) 严重肝功能损害时慎用，低血钾可能造成肝性脑病。(4) 无尿或严重肾功能减退者（GFR ≤ 每分钟 20 ml）慎用。(5) 能通过胎盘屏障，对妊娠高血压综合征无预防作用，故妊娠

期妇女使用应慎重。(6) 哺乳期妇女不宜服用。

【禁忌证】【不良反应】见氢氯噻嗪。

【用法与用量】口服：(1) 成人剂量：①治疗水肿性疾病，一日 25 ~ 100 mg，或隔日 100 ~ 200 mg；或一日 100 ~ 200 mg，一周连服 3 日。当肾脏疾病肾小球滤过率低于每分钟 10ml 时，用药间歇应在 24 ~ 48 小时以上。②治疗高血压，一次 25 ~ 100 mg，一日 1 次或隔日 1 次，与其他抗高血压药联合应用时一日 12.5 ~ 25 mg。(2) 儿童剂量：按体重一次 2 mg/kg，一日 1 次，一周连服 3 日。

【制剂与规格】氯噻酮片：① 50 mg；② 100 mg。

4.6.2 襻利尿药

呋塞米[基(基)，保(甲)]

Furosemide

【适应证】(1) 充血性心力衰竭，肝硬化，肾脏疾病（肾炎、肾病及各种原因所致的急慢性肾衰竭），与其他药物合用治疗急性肺水肿和急性脑水肿等。(2) 预防急性肾衰竭。用于各种原因导致的肾脏血流灌注不足，如失水、休克、中毒、麻醉意外以及循环功能不全等。在纠正血容量不足的同时及时应用，可减少急性肾小管坏死的机会。(3) 高血压危象。(4) 高钾血症、高钙血症、稀释性低钠血症（尤其是当血钠浓度低于 120 mmol/L 时）。(5) 抗利尿激素分泌过多症。(6) 急性药物及毒物中毒。

【注意事项】(1) 对磺胺药和噻嗪类利尿药过敏者，对本药可能亦过敏。(2) 无尿或严重肾功能损害者慎用，后者因需加大剂量，故用药间隔时间应延长，以免出现耳毒性等不良反应。(3) 可通过胎盘屏障，妊娠期妇女尤其是妊娠前 3 个月应尽量避免应用。(4) 可经乳汁分泌，哺乳期妇女应慎用。(5) 下列情况慎用，如糖尿病，高尿酸血症或痛风，急性心肌梗死，胰腺炎或有此病史者，有低钾血症倾向者（尤其是应用洋地黄类药物或有室性心律失常者），红斑狼疮，前列腺肥大。(6) 本药在新生儿的半衰期明显延长，故新生儿用药间隔应延长。(7) 老年人应用本药时发生低血压、电解质紊乱，血栓形成和肾功能损害的机会增多。(8) 在用药期间，应定期检查血电解质、血压、肾功能、血糖、血尿酸、酸碱平衡情况、听力。(9) 药物剂量应从小剂量开始，然后根据利尿反应调整剂量，以减少水、电解质紊乱等不良反应的发生。(10) 存在低钾血症或低钾血症倾向时，应注意补充钾盐。(11) 肠道外用药宜静脉给药、不主张肌内注射。常规剂量静脉注射时间应超过 1 ~ 2 分钟，大剂量静脉注射时每分钟不超过 4 mg，静脉用药剂量为口服的 1/2 时即可达到同样疗效。(12) 注射液为加碱制成的钠盐注射液，碱性较高，故静脉注射时宜用氯化钠注射液稀释，而不宜用葡萄糖注射液稀释。(13) 与降压药合用时，后者剂量应酌情调整。(14) 少尿或无尿患者应用最大剂量后 24 小时仍无效时应停药。

【禁忌证】对磺酰胺类、噻嗪类药物过敏者，低钾血症、肝性脑病、超量服用洋地黄者。

【不良反应】(1) 常见与水、电解质紊乱有关的症状，如直立性低血压，休克，低钾血症，低氯血症，低氯性碱中毒，低钠血症，低钙血症以及与此有关的口渴，乏力，肌肉酸痛，心律失常；(2) 少见过敏反应（皮疹、间质性肾炎、心搏骤停），视觉模糊，黄视症，光敏感，头晕，头痛，食欲缺乏，恶心，呕吐，腹痛，腹泻，胰腺炎，肌肉强直，粒细胞减少，血小板减少性紫癜，再生障碍性贫血，肝功能损害，指（趾）感觉异常，高糖血症，尿糖阳性，原有糖尿病加重，高尿酸血症。耳鸣、听力障碍多见于大剂量静脉快速注射时（每分钟剂量 > 4 ~ 15 mg），多为暂时性，少数为不可逆性，尤其当与其他有耳毒性的药物同时应用时。在高钙血症时，可引起肾结石。尚有报道本药可加重特发性水肿。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，水肿性疾病，起始 20 ~ 40 mg，一日 1 次，必要时 6 ~ 8 小时后追加 20 ~ 40 mg，直至出现满意利尿效果。最大剂量虽可达一日 600 mg，但一般应控制在 100 mg 以内，分 2 ~ 3 次服，以防过度利尿和

不良反应发生。部分患者剂量可减少至20～40 mg，隔日1次，或一周中连续服药2～4日，一日20～40 mg。高血压，起始一日40～80 mg，分2次服用，并酌情调整剂量。高钙血症，一日80～120 mg，分1～3次服。②儿童。治疗水肿性疾病，起始按体重2 mg/kg，必要时4～6小时追加1～2 mg/kg。一日最高不超过40 mg。新生儿应延长用药间隔。(2) 静脉注射：①成人，水肿性疾病，紧急情况或不能口服者，可静脉注射，开始20～40 mg，必要时每2小时追加剂量，直至出现满意疗效。维持用药阶段可分次给药。急性左心衰竭，起始40 mg静脉注射，必要时每小时追加80 mg，直至出现满意疗效。急性肾衰竭，可200～400 mg加入100 ml氯化钠注射液内静脉滴注，滴注速度不超过每分钟4 mg。有效者可按原剂量重复应用或酌情调整剂量，一日总剂量不超过1 g。利尿效果差时不宜再增加剂量，以免出现肾毒性，对急性肾衰竭恢复不利。慢性肾功能不全，通常一日40～120 mg。高血压危象，起始40～80 mg，伴急性左心衰竭或急性肾衰竭时，可酌情增加剂量。高钙血症，一次20～80 mg。

【制剂与规格】呋塞米片：20 mg。

呋塞米注射液：2 ml：20 mg。

复方呋塞米片：每片含呋塞米20 mg、盐酸阿米洛利2.5 mg，口服，一日1次，一次1片。早晨服用，必要时可增至一日2片，或遵医嘱。

布美他尼[保(乙)]

Bumetanide

【适应证】(1) 水肿性疾病。充血性心力衰竭，肝硬化，肾脏疾病（肾炎、肾病及各种原因所致的急慢性肾衰竭），与其他药物合用治疗急性肺水肿和急性脑水肿等。(2) 预防急性肾衰竭。用于各种原因导致的肾脏血流灌注不足，如失水、休克、中毒、麻醉意外以及循环功能不全等，在纠正血容量不足的同时及时应用，可减少急性肾小管坏死的机会。(3)高血压危象。(4) 高钾血症、高钙血症、稀释性低钠血症（尤其是当血钠浓度低于120 mmol/L时）。(5) 抗利尿激素分泌过多症。(6) 急性药物及毒物中毒。(7) 对某些呋塞米无效的病例仍可能有效。

【注意事项】【禁忌证】见呋塞米。

【不良反应】有报道本药偶见未婚男性遗精和阴茎勃起困难。大剂量时可发生肌肉酸痛、胸痛、男性乳腺发育。对糖代谢的影响可能小于呋塞米。其他同呋塞米。

【用法与用量】(1) 水肿性疾病。①口服：成人，初始剂量一次0.5～2 mg，一日1次，必要时每隔4～5小时重复，最大剂量一日10～20 mg。也可间隔用药，即隔1～2日用药1日。儿童，口服按体重一次0.01～0.02 mg/kg，一日1次，必要时4～6小时1次。②肌内注射或静脉注射：成人，起始一次0.5～1 mg，必要时每隔2～3小时重复，最大剂量一日10 mg。儿童，按体重一次0.01～0.02 mg/kg，必要时4～6小时1次。(2) 急性肺水肿及左心衰竭。①静脉注射：起始一次1～2 mg，必要时隔20分钟重复。②静脉滴注：一次2～5 mg，加入0.9%氯化钠注射液500 ml中稀释后，缓慢静脉滴注，滴注时间不短于30～60分钟。

【制剂与规格】布美他尼片：1 mg。

布美他尼钠注射液：① 2 ml：0.5 mg；② 2 ml：1 mg。

注射用布美他尼钠：① 0.5mg；② 1mg。

托拉塞米[保(乙)]

Torasemide

【适应证】充血性心力衰竭引起的水肿，肝硬化腹水，肾脏疾病所致水肿，原发性高血压。

【注意事项】(1) 肝硬化和肝腹水患者慎用本品，以防止由于体液和电解质平衡突然改变可能导致的肝性脑病。(2) 未在妊娠期妇女中进行过充分的对照试验，妊娠期妇女服用本品时需权衡利弊。(3) 目前尚不知本品是否能在人乳汁分泌，哺乳期妇女应慎用本品。(4) 对儿童患者是否安全有效尚不明确。(5) 老年人使用本品的疗效和安全性与年轻人无区别，但老年患者使用本品初期尤其需注意监测血压、电解质和有无血容量不足和有无排尿困难。(6) 在用药期间，应定期检查电解质

(特别是血钾)、血糖、尿酸、肌酐、血脂等。(7) 本品与醛固酮拮抗药一起使用可防止低钾血症和代谢性碱中毒。(8) 前列腺肥大的患者排尿困难，使用本品尿量增多可导致尿潴留和膀胱扩张。(9) 本品必须缓慢静脉注射，不应与其他药物混合后静脉注射，但可根据需要可用0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液稀释。(10) 如需长期用药，建议尽早从静脉给药转为口服用药，静脉给药疗程限于1周。

【禁忌证】肾衰竭无尿患者、肝性脑病前期或肝性脑病患者、对本品或磺酰脲类药过敏患者、低血压、低血容量、低钾或低钠血症患者、严重排尿困难（如前列腺肥大）者禁用。

【不良反应】常见头痛，头晕，乏力，失眠，鼻炎，咳嗽，腹泻，胸痛，心电图异常，便秘，恶心，消化不良，食欲缺乏，关节痛，咽喉痛，肌肉痛，水肿，神经质，排尿过度；高血糖症，低钾血症（多见于低钾饮食、呕吐、腹泻、快速给药、肝功能异常等）；偶见瘙痒，皮疹，光敏反应；罕见口干，肢体感觉异常，视觉障碍。

【用法与用量】(1) 口服：①充血性心力衰竭，初始剂量一次10 mg，一日1次，根据病情需要可增至一次20mg，一日1次。②原发性高血压，起始剂量一次5 mg，一日1次，4～6周降压作用不理想可增至一次10 mg，一日1次，若一日10 mg仍未取得足够的降压作用，可考虑合用其他降压药。(2) 注射：①充血性心力衰竭所致的水肿、肝硬化腹水：一般初始剂量为一次5 mg或10 mg，一日1次，缓慢静脉注射，也可以用5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液稀释后进行静脉注射；如疗效不满意可增加剂量至一次20 mg，一日1次，一日最大剂量为40 mg，疗程不超过1周。②肾脏疾病所致的水肿，初始剂量一次20 mg，一日1次，以后根据需要可逐渐增加剂量至最大剂量一日100 mg，疗程不超过1周。

【制剂与规格】托拉塞米片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

托拉塞米胶囊：10 mg。

托拉塞米注射液：① 1 ml：10 mg；② 2 ml：20 mg；③ 5 ml：50 mg。

注射用托拉塞米：①10 mg；②20 mg。

4.6.3 保钾利尿药

螺内酯[基(基)、保(甲)]

Spironolactone

【适应证】(1) 水肿性疾病。与其他利尿药合用，治疗充血性水肿、肝硬化腹水、肾性水肿等水肿性疾病，其目的在于纠正上述疾病时伴发的继发性醛固酮分泌增多，并对抗其他利尿药的排钾作用。也用于特发性水肿的治疗。(2) 高血压。作为治疗高血压的辅助药物。(3) 原发性醛固酮增多症。本品可用于此病的诊断和治疗。(4) 低钾血症的预防。与噻嗪类利尿药合用，增强利尿效应和预防低钾血症。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用，因本药引起电解质紊乱，可诱发肝性脑病。(2) 肾功能不全者慎用。(3) 本药可通过胎盘，但对胎儿的影响尚不清楚。孕妇应在医师指导下用药，且用药时间应尽量短。(4) 下列情况慎用，如无尿、低钠血症、酸中毒、乳房增大或月经失调者。(5) 老年人用药较易发生高钾血症和利尿过度。(6) 给药应个体化，从最小有效剂量开始使用，以减少电解质紊乱等不良反应的发生。如一日服药一次，应于早晨服药，以免夜间排尿次数增多。(7) 用药前应了解患者血钾浓度，但在某些情况血钾浓度并不能代表机体内钾含量，如酸中毒时钾从细胞内转移至细胞外而易出现高钾血症，酸中毒纠正后血钾即可下降。(8) 本药起作用较慢，而维持时间较长，故首日剂量可增加至常规剂量的2～3倍，以后酌情调整剂量。与其他利尿药合用时，可先于其他利尿药2～3日服用。在已应用其他利尿药再加用本药时，其他利尿药剂量在最初2～3日可减量50%，以后酌情调整剂量。在停药时，本药应先于其他利尿药2～3日停药。(9) 用药期间如出现高钾血症，应立即停药。(10) 应于进食时或餐后服药，以减少胃肠道反应，并可能提高本药的生物利用度。

【禁忌证】高钾血症，低钠血症患者禁用。

【不良反应】(1) 常见：①高钾血症，

最为常见，尤其是单独用药、进食高钾饮食、与钾剂或含钾药物如青霉素钾等以及存在肾功能损害、少尿、无尿时。即使与噻嗪类利尿药合用，高钾血症的发生率仍可达 8.6% ~ 26%，且常以心律失常为首发表现，故用药期间必须密切随访血钾和心电图；②胃肠道反应，如恶心、呕吐、胃痉挛和腹泻，尚有报道可致消化性溃疡。(2) 少见：①低钠血症，单独应用时少见，与其他利尿药合用时发生率增高；②抗雄激素样作用或对其他内分泌系统的影响，长期服用本药在男性可致男性乳房发育、阳痿、性功能低下，在女性可致乳房胀痛、声音变粗、毛发增多、月经失调、性功能下降；③中枢神经系统表现，长期或大剂量服用本药可发生行走不协调、头痛等。(3) 罕见：①过敏反应，出现皮疹甚至呼吸困难；②暂时性血清肌酐、尿素氮升高，主要与过度利尿、有效血容量不足、引起肾小球滤过率下降有关；③轻度高氯性酸中毒；④肿瘤，有报道 5 例患者长期服用本药和氢氯噻嗪发生乳腺癌。

【用法与用量】口服：(1) 成人。①水肿性疾病一日 40 ~ 120 mg，分 2 ~ 4 次服，至少连服 5 日。以后酌情调整剂量。②高血压开始一日 40 ~ 80 mg，分 2 ~ 4 次服，至少 2 周，以后酌情调整剂量，不宜与血管紧张素转换酶抑制药合用，以免增加发生高钾血症的机会。③原发性醛固酮增多症，手术前患者一日 100 ~ 400 mg，分 2 ~ 4 次服用。不宜手术的患者，则选用较小剂量维持。③诊断原发性醛固酮增多症。螺内酯试验，一日 400 mg，分 2 ~ 4 次服，连续 3 ~ 4 周。老年人开始用量宜偏小。④慢性心力衰竭：初始剂量一日 10 mg，最大剂量一日 20 mg。(2) 儿童。治疗水肿性疾病，开始按体重一日 1 ~ 3 mg/kg 或按体表面积一日 30 ~ 90 mg/m^2，单次或分 2 ~ 4 次服，连服 5 日后酌情调整剂量，最大剂量为一日 3 ~ 9 mg/kg 或 90 ~ 270 mg/m^2。

【制剂与规格】螺内酯片：20 mg。

螺内酯胶囊：20 mg。

氨苯蝶啶 [基(基)，保(甲)]

Triamterene

【适应证】慢性心力衰竭，肝硬化腹水，肾病综合征，肾上腺糖皮质激素治疗过程中发生的水钠潴留，特发性水肿。亦用于对氢氯噻嗪或螺内酯无效者。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用。(2) 肾功能不全者慎用。(3) 动物实验显示本药能透过胎盘，但在人类的情况尚不清楚，孕妇慎用。(4) 在母牛的实验显示本药可经乳汁分泌，但在人类的情况尚不清楚。哺乳期妇女慎用。(5) 下列情况慎用，如无尿、糖尿病、低钠血症、酸中毒、高尿酸血症或有痛风病史者、肾结石或有病史者。(6) 老年人应用本药时发生高钾血症和肾损害。(7) 用药期间应随时注意血常规变化、肝功能或其他特异反应，随时调整剂量。(8) 给药应个体化，从最小有效剂量开始使用，以减少电解质紊乱等不良反应。如一日给药 1 次，应于早晨给药，以免夜间排尿次数增多。

【禁忌证】高钾血症者禁用。

【不良反应】常见高钾血症；偶见恶心、呕吐、嗜睡、轻度腹泻、软弱、口干及皮疹、肝损害、肝功能异常等；大剂量长期使用或与螺内酯合用，可出现血钾过高现象，停药后症状可逐渐消失；少见低钠血症、头晕、头痛、光敏感；罕见过敏反应、血液系统损害（粒细胞减少、血小板减少性紫癜、巨幼细胞贫血）、肾结石。

【用法与用量】口服：①成人，初始剂量一日 25 ~ 100 mg，分 2 次服用，与其他利尿药合用时，剂量可减少。维持阶段可改为隔日疗法。最大剂量不超过一日 300 mg。②儿童，初始剂量按体重一日 2 ~ 4 mg/kg 或按体表面积 120 mg/m^2，分 2 次服用，一日或隔日疗法，以后酌情调整剂量，最大剂量不超过一日 6 mg/kg 或 300 mg/m^2。

【制剂与规格】氨苯蝶啶片：50 mg。

氨苯蝶啶 - 氢氯噻嗪片：每片含氨苯蝶啶 50 mg、氢氯噻嗪 25 mg。

阿米洛利[保（乙）]

Amiloride

【适应证】主要治疗水肿性疾病，亦可用于难治性低钾血症的辅助治疗。

【注意事项】(1) 肾功能损害者慎用。(2) 此药对孕妇有无不良作用尚不明确，如出现低钾血症应在医师指导下用药。(3) 尚无实验证实本药能否经乳汁分泌，哺乳期妇女慎用。(4) 下列情况慎用，如少尿、糖尿病、酸中毒和低钠血症。(5) 儿童用药尚不明确。(6) 老年人应用本药较易出现高钾血症和肾损害等，用药期间应密切观察。(7)用药期间应定期查血钾、钠、氯。如发生高钾血症，应立即停药，并作相应处理。(8) 给药应个体化，从最小有效剂量开始使用，以减少电解质紊乱等不良反应。(9) 用药前应了解血钾浓度，但在某些情况下血钾浓度并不能真正反应体内钾潴量，如酸中毒时钾从细胞内转移至细胞外而易出现高钾血症，酸中毒纠正后血钾浓度即可下降。(10) 应于进食时或餐后服药，以减少胃肠道反应。(11) 如一日给药 1 次，应于早晨给药以免夜间排尿数增多。

【禁忌证】严重肾功能不全及高钾血症者禁用。

【不良反应】常见高钾血症；偶见低钠血症，高钙血症，轻度代谢性酸中毒；胃肠道反应，头痛，头晕，胸闷，性功能低下，过敏反应（皮疹、呼吸困难）。

【用法与用量】口服：成人，一次 2.5 mg，一日 1 次，必要时一次 2.5 mg，一日 2 次，与食物同服。

【制剂与规格】盐酸阿米洛利片：① 2.5 mg；② 5 mg。

复方盐酸阿米洛利片：每片含盐酸阿米洛利 2.5 mg，氢氯噻嗪 25 mg。口服，一日 1 ~ 2 次，一次 1 ~ 2 片，与食物同服。

4.6.4 其他利尿药

吲达帕胺[基（基），保（甲）]

Indapamide

【适应证】原发性高血压。

【注意事项】(1) 妊娠妇女应避免使用。(2) 因为药物可能进入乳汁，哺乳期妇女应避免服用。(3) 交感神经切除术后慎用。(4) 老年人慎用。(5) 在用药期间应定期检查血电解质。

【禁忌证】对磺胺过敏者；严重肾功能不全；肝性脑病或严重肝功能不全；低钾血症。

【不良反应】腹泻，头痛、食欲缺乏、失眠、反胃、直立性低血压；有皮疹、瘙痒等过敏反应；低血钠、低血钾、低氯性碱中毒。

【用法与用量】口服：①普通制剂：一次 2.5 mg，一日 1 次。②缓释制剂：一日 1.5 mg，最好早晨服用，药片不能掰开或嚼碎，加大剂量并不能提高吲达帕胺的抗高血压疗效，只能增加利尿作用。

【制剂与规格】吲达帕胺片：2.5 mg。

吲达帕胺胶囊：2.5 mg。

吲达帕胺滴丸：2.5 mg。

吲达帕胺缓释片：1.5 mg。

吲达帕胺缓释胶囊：1.5 mg。

4.7 β肾上腺素受体拮抗药

β肾上腺素受体拮抗药（beta-adrenoceptor blocking drug），简称β受体拮抗药，能阻断心脏、外周血管β受体，已广泛应用于心血管疾病。许多β受体拮抗药应用于临床疾病虽有等效应，但在治疗特殊疾病时可能选择不同的β受体拮抗药，并在应用中应注意个体差异。用于心血管疾病，不宜采用具有内源性拟交感活性的β受体拮抗药，因为它们不引起心率减慢。β受体拮抗药作用时间相对较短，需一日 2 次或 3 次服用，经过制剂的改型，缓释剂型可以一日 1 次服用，适合高血压治疗。尽管为缓释剂型，用于心绞痛治疗时往往一日 2 次给药。有些β受体拮抗药如阿替洛尔和比索洛尔作用时间较长，可以一日 1 次给药。

β受体拮抗药减慢心率，抑制心肌，故严重心动过缓（心率＜每分钟 55 次）或二度、三度房室传导阻滞患者禁用。β受体拮抗药不应用于病情不稳定型心力衰竭患者。收缩压＜ 90 mmHg 者不用。β受体拮抗药可诱发哮喘，有哮喘史和支气

管痉挛的患者应避免应用，若必需时应选用心脏选择性 β 受体拮抗药，而且使用时应格外小心。β 受体拮抗药有脂溶性和水溶性之分，脂溶性 β 受体拮抗药（如美托洛尔）可能引起睡眠障碍，水溶性 β 受体拮抗药（如阿替洛尔）从肾脏排泄，肾受损时剂量应减量。索他洛尔可延长心电图 QT 间期，偶引起致命的室性心动过速，服用索他洛尔的患者应注意避免低血钾的发生。

β 受体拮抗药常用于高血压、心绞痛、慢性稳定型收缩性心力衰竭和部分心律失常患者。

高血压（hypertension）β 受体拮抗药通过降低心排血量，改变压力感受器反射的敏感性，阻滞外周血管 β 受体和抑制肾素分泌等机制降低血压。在快速心律失常（窦速，房颤）、冠心病（稳定或不稳定型心绞痛、心肌梗死）和心力衰竭合并高血压的患者治疗中，具有不可替代的地位。此外，高血压伴心率增快，焦虑、精神压力大等交感神经活性过高的患者，围手术期高血压，青光眼和妊娠高血压患者也宜用 β 受体拮抗药。β 受体拮抗药主要用于轻中度高血压，尤其是静息时心率较快的中青年患者或合并心绞痛者。在高血压合并冠心病或慢性稳定型心力衰竭患者应常规使用 β 受体拮抗药。

对于无并发症的高血压患者，特别是老年无并发症的高血压患者，可能其他抗高血压药比 β 受体拮抗药更适合常规初始治疗。在无并发症的高血压合并糖尿病患者，或有发生糖尿病的高危患者，应避免使用 β 受体拮抗药，特别是避免 β 受体拮抗药和氢氯噻嗪联合使用。在嗜铬细胞瘤患者，为了控制心率，常用 β 受体拮抗药，但为了避免高血压危象发生，应与 α 受体拮抗药酚苄明联合使用。

常用于高血压治疗的 β 受体拮抗药有普萘洛尔、阿替洛尔、美托洛尔、比索洛尔、拉贝洛尔和卡维地洛等。

慢性稳定型心绞痛（chronic stable angina）β 受体拮抗药用于冠心病二级预防。通过降低心肌耗氧，减少心脏作功而缓解心绞痛症状，改善运动耐力，特别是有效控制劳力性心绞痛。β 受体拮抗药剂量应个体化，根据心率调整剂量，静息心率每分钟 50 ~ 60 次为目标剂量。常规剂量：普萘洛尔一次 10 ~ 20 mg，一日 2 ~ 3 次，美托洛尔（酒石酸美托洛尔）一次 25 ~ 100 mg，一日 2 次，美托洛尔缓释片（琥珀酸美托洛尔）一次 50 ~ 200 mg，一日 1 次，阿替洛尔一次 25 ~ 50 mg，一日 1 次，比索洛尔一次 5 ~ 10 mg，一日 1 次。

ST 段抬高急性心肌梗死（ST-elevation myocardial infarction，STEMI）在无心力衰竭、低心排血量、心源性休克危险以及其他 β 受体拮抗药相对禁忌证者，在 24 小时内开始口服 β 受体拮抗药。合并高血压的患者可先静脉注射 β 受体拮抗药，如美托洛尔 5 mg 静脉注射，必要时可每 5 分钟重复 1 次，总量 15 mg。最后一次静脉注射后开始口服美托洛尔 25 ~ 50 mg，每 6 ~ 8 小时 1 次，48 小时后用维持量一次 25 ~ 100 mg，一日 2 次。有条件者应使用美托洛尔缓释片（琥珀酸美托洛尔）一日 1 次口服。使用期间应监测血压、心率、心律和心电图，并听诊肺部啰音。β 受体拮抗药的目标心率为每分钟 60 次左右。急性期早期应用 β 受体拮抗药可降低早期死亡率。

不稳定型心绞痛 / 非 ST 段抬高心肌梗死（unstable angina/non ST-elevation myocardial infarction，UA/NSTEMI）患者，如无禁忌证，应尽早使用 β 受体拮抗药，高危及进行性静息性心绞痛患者，可先静脉注射 β 受体拮抗药，然后改为口服，中、低危患者可以口服 β 受体拮抗药。

慢性稳定型收缩性心力衰竭（chronic stable systolic heart failure）β 受体拮抗药阻断慢性心力衰竭时肾上腺素能系统的激活介导的心肌重构。所有慢性收缩性心力衰竭 NYHA Ⅱ－Ⅳ级，无禁忌证，无液体潴留，体重恒定，病情稳定的患者必须应用 β 受体拮抗药。通常在 ACEI 和利尿药基础上加用 β 受体拮抗药。在应用低或中等剂量 ACEI 时即可及早加用 β 受体拮抗药，以尽早发挥 β 受体拮抗药降低猝死的作用，并可发挥两药的协同作用。

β受体拮抗药应小剂量开始，根据患者耐受情况（血压、心率、心力衰竭症状和体重）逐渐增加剂量，每2～4周剂量加倍至目标剂量或最大耐受剂量。

起始剂量：琥珀酸美托洛尔12.5 mg，一日1次，比索洛尔1.25 mg，一日1次，卡维地洛一次3.125 mg，一日2次，酒石酸美托洛尔一次6.25 mg，一日3次。剂量确定应以心率为准，清晨静息心率每分钟55～60次，不低于每分钟55次为最大耐受剂量或目标剂量。

目标剂量：琥珀酸美托洛尔一日200 mg，酒石酸美托洛尔一次50 mg，一日3次，比索洛尔一日10 mg，卡维地洛一次25 mg，一日2次。

治疗期间应注意低血压、心动过缓、液体潴留、体重和心力衰竭恶化等。

普萘洛尔[基(基)，保(甲/乙)]

Propranolol

【适应证】用于高血压，心绞痛，室上性快速心律失常、室性心律失常，心肌梗死，肥厚型心肌病，嗜铬细胞瘤，偏头痛、非丛集性头痛。

【注意事项】(1) 可通过胎盘进入胎儿体内，有报道妊娠高血压者用后可导致宫内胎儿发育迟缓，分娩时无力造成难产，新生儿可产生低血压、低血糖、呼吸抑制及心律减慢，尽管有报道对母亲及胎儿均无影响，但必须慎用，不宜作为孕妇第一线治疗用药。(2) 可少量从乳汁分泌，故哺乳期妇女慎用。(3) 以下情况慎用，如过敏史，充血性心力衰竭，糖尿病，肺气肿，肝功能不全，甲状腺功能减退，雷诺综合征或其他周围血管疾病，肾功能减退等。(4) 老年人应用时，因对药物代谢与排泄能力低，应适当调节剂量。(5) 用药期间，应定期检查血常规、血压、心功能、肝肾功能等。(6) β受体拮抗药的耐受量个体差异大，用量必须个体化。首次使用本品时需从小剂量开始，逐渐增加剂量并密切观察反应以免发生意外。(7) 冠心病患者使用本品不宜骤停，否则可出现心绞痛、心肌梗死或室性心动过速。(8) 甲状腺功能亢进患者用本品也不可骤停，否则使甲状腺功能亢进症状加重。(9) 长期应用本品可有少数患者出现心力衰竭，倘若出现，可用洋地黄苷类和（或）利尿药纠正，并逐渐递减剂量，最后停用。(10) 糖尿病患者可引起血糖过低，非糖尿病患者无降糖作用。故糖尿病患者应定期检查血糖。

【禁忌证】支气管哮喘；心源性休克；二或三度房室传导阻滞；重度心力衰竭；窦性心动过缓。

【不良反应】(1) 眩晕，头晕，支气管痉挛，呼吸困难，充血性心力衰竭，神志模糊（尤见于老年人），精神抑郁，反应迟钝，发热，咽痛，粒细胞缺乏，出血倾向（血小板减小），四肢冰冷，腹泻，倦怠，眼、口、皮肤干燥，指（趾）麻木，异常疲乏等；嗜睡，失眠，恶心，皮疹；(2) 个别病例有周身性红斑狼疮样反应，多关节病综合征，幻视，性功能障碍（或性欲下降）；(3) 剂量过大时引起低血压（血压下降），心动过缓，惊厥，呕吐，可诱发缺血性脑梗死，可有心源性休克，甚至死亡。

【用法与用量】(1) 口服：①高血压，初始剂量一次10 mg，一日3～4次，可单独使用或与利尿药合用。剂量应逐渐增加，一日最大剂量200 mg。②心绞痛，一次5～10 mg，一日3～4次；每3日可增加10～20 mg，可渐增至一日200 mg，分次服用。③室上性、室性快速性心律失常，一次10～30 mg，一日3～4次，根据需要及耐受程度调整用量。④心肌梗死，一次30～240 mg，一日2～3次。⑤肥厚型心肌病，一次10～20 mg，一日3～4次。按需要及耐受程度调整剂量。⑥嗜铬细胞瘤患者控制心动过速，一次10～20 mg，一日3～4次，术前用3日，一般应先用α受体拮抗药，待药效稳定后加用本品。⑦偏头痛，一日30～100 mg，分3次服。宜从小剂量开始，逐渐增加达到最适治疗剂量。(2) 静脉注射：①成人，缓慢注射一次1～3 mg，必要时5分钟后可重复，总量5 mg。②儿童，按体重一次0.01～0.1 mg/kg，缓慢注入（> 10分钟），不宜超过1 mg。

【制剂与规格】盐酸普萘洛尔片：10 mg。

盐酸普萘洛尔缓释片：① 40 mg；② 80 mg。

盐酸普萘洛尔缓释胶囊：40 mg。

盐酸普萘洛尔注射液：5 ml : 5 mg。

注射用盐酸普萘洛尔：① 2 mg；② 5 mg。

阿替洛尔 [基(基). 保(甲)]

Atenolol

【适应证】用于高血压、心绞痛、心肌梗死、心律失常、甲状腺功能亢进症、嗜铬细胞瘤。

【注意事项】(1) 肾功能不全者需调整剂量。肌酐清除率＜每分钟 15 ml/1.73 m^2 者，一日 25 mg；每分钟 15 ~ 35 ml/1.73 m^2 者，一日最大剂量 50 mg。(2) 本品可透过胎盘并出现在脐带血液里，缺乏头 3 个月使用本药的研究，胎儿有受损的可能。妊娠妇女较长时间服用本药，与胎儿宫内生长迟缓有关。(3) 本品在乳汁中有明显的聚集，哺乳期妇女服用时应谨慎小心。(4) 下列情况慎用，如有慢性阻塞性肺部疾病的高血压患者。(5) 儿童注意监测心率、血压。(6) 老年人用药时所需剂量可以减少，尤其是肾功能减退的患者。(7) 有心力衰竭症状的患者用本品时，与洋地黄或利尿药合用，如心力衰竭症状仍存在，应逐渐减量使用。(8) 本品停药过程至少 3 日，常可达 2 周，如果有撤药症状，如心绞痛发作，则暂时再给药，待稳定后渐停用。(9) 本品可改变因血糖降低而引起的心动过速。(10) 本药可使末梢动脉血循环失调，患者可能对用于治疗过敏反应常规剂量的肾上腺素无反应。

【禁忌证】二或三度房室传导阻滞、心源性休克、病窦综合征及严重窦性心动过缓、支气管哮喘患者。

【不良反应】可见低血压，心动过缓，头晕，四肢冰冷，疲劳，乏力，肠胃不适，精神抑郁，脱发，血小板减少症，银屑病样皮肤反应，银屑病恶化，皮疹及干眼，心脏传导阻滞。

【用法和剂量】口服：①成人，初始剂量，一次 6.25 ~ 12.5 mg，一日 2 次，按需要及耐受量渐增至 50 ~ 200 mg。②儿童，初始剂量，按体重一次 0.25 ~ 0.5 mg/kg，一日 2 次。

【制剂与规格】阿替洛尔片：① 12.5 mg；② 25 mg；③ 50 mg；④ 100 mg。

美托洛尔 [基(基). 保(甲/乙)]

Metoprolol

【适应证】用于高血压，心绞痛，心肌梗死，肥厚型心肌病，主动脉夹层，心律失常，心房颤动控制心室率，甲状腺功能亢进症，心脏神经症，慢性心力衰竭，室上性快速型心律失常，预防和治疗急性心肌梗死患者的心肌缺血、快速型心律失常和胸痛。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肝脏功能不全、低血压、心脏功能不全、慢性阻塞性肺部疾病。(2) 对胎儿和新生儿可产生不利影响，尤其是心动过缓，孕妇不宜使用。(3) 嗜铬细胞瘤应先行使用 α 受体拮抗药。(4) 对于要进行全身麻醉的患者，至少在麻醉前 48 小时停用。

【禁忌证】重度或急性心力衰竭、二或三度房室传导阻滞、失代偿性心力衰竭(肺水肿，低灌注和低血压)、有临床意义的窦性心动过缓或病态窦房结综合征、心源性休克、末梢循环灌注不良、严重的周围血管疾病、哮喘及喘息性支气管炎、治疗室上性快速心律失常时，收缩压＜110 mmHg 的患者不宜采用酒石酸美托洛尔静脉给药。

【不良反应】可见心率减慢，心脏传导阻滞，血压降低，心力衰竭加重，外周血管痉挛导致的四肢冰冷或脉搏不能触及，雷诺现象，疲乏和眩晕，抑郁，头痛，多梦，失眠，幻觉，恶心，胃痛，便秘，腹泻，气急，关节痛，瘙痒，腹膜后腔纤维变性，耳聋，眼痛等。

【用法与剂量】(1) 口服：①高血压，普通制剂一次 100 ~ 200 mg，一日 2 次；缓释制剂一次 47.5 ~ 95 mg，一日 1 次；控释制剂一日 0.1g，早晨顿服或遵医嘱。②心绞痛、心律失常、肥厚型心肌病、甲状腺功能亢进，普通制剂一次 25 ~ 50 mg，一日 2 ~ 3 次，或一次 100 mg，一日 2 次；缓释制剂一次 95 ~ 190 mg，一日 1 次；控释制剂，一日 0.1 g，早晨顿服。③心力衰竭，应在

使用洋地黄和（或）利尿药、ACEI等抗心力衰竭的治疗基础上使用本药。酒石酸美托洛尔，初始剂量一次6.25 mg，一日2～3次，以后视临床情况每2～4周可增加剂量，一次6.25～12.5 mg，一日2～3次。最大剂量可用至一次50～100 mg，一日2次。琥珀酸美托洛尔缓释片，心功能Ⅱ级的稳定型心力衰竭患者，治疗起始的2周内，一次23.75 mg，一日1次，以后每2周剂量可加倍。长期治疗的目标用量为一次190 mg，一日1次。心功能Ⅲ～Ⅳ级的稳定型心力衰竭患者，起始剂量一次11.875 mg，一日1次，剂量应个体化，在增加剂量过程中应密切观察患者，因为某些患者的心力衰竭症状可能会加重。1～2周后，剂量可增至一次23.75 mg，一日1次，2周后剂量可加倍，对于那些能耐受更高剂量的患者，每2周可将剂量加倍，最大可至一次190 mg，一日1次。(2) 静脉注射：由于注射给药易出现心率、血压及心排血量的急剧变化，故应在心电监测下谨慎使用。①急性心肌梗死、不稳定型心绞痛，立即静脉给药一次5mg，这一剂量可在间隔2分钟后重复给予，直到最大剂量一次15 mg。之后15分钟开始口服本品，一次25～50 mg，6～12小时1次，共24～48小时，以后50～100 mg，一日2次。有下列情况的患者不能立即静脉给药：心率＜每分钟70次，收缩压＜110 mmHg，或一度房室传导阻滞。②室上性快速型心律失常，初始以每分钟1～2 mg的速度静脉注射，一次5 mg；如病情需要，可间隔5分钟重复注射，总剂量10～15 mg，注射后4～6小时，心律失常已经控制，用口服制剂维持，一日2～3次，每次剂量不超过50 mg。

【制剂与规格】酒石酸美托洛尔片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

酒石酸美托洛尔缓释片：100 mg。

酒石酸美托洛尔控释片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

酒石酸美托洛尔胶囊：① 25 mg；② 50 mg。

酒石酸美托洛尔注射液：① 2 ml：2 mg；② 5 ml：5 mg。

注射用酒石酸美托洛尔：① 2 mg；② 5 mg。

琥珀酸美托洛尔缓释片：① 23.5 mg；② 47.5 mg；③ 95 mg；④ 190 mg。

比索洛尔[保(乙)]

Bisoprolol

【适应证】用于高血压、冠心病、期前收缩、快速性室上性心动过速、中至重度慢性稳定性心力衰竭。

【注意事项】(1) 和其他β受体拮抗药一样，比索洛尔可能增加机体对过敏原的敏感性和加重过敏反应，此时肾上腺素治疗不一定会产生预期的治疗效果。(2) 比索洛尔可能损害孕妇和（或）胎儿（新生儿），一般情况下β受体拮抗药能够降低胎盘灌注，而胎盘灌注与发育迟缓、子宫内死亡、早产有关。在胎儿和新生儿，可能发生低血糖和心动过缓等不良反应。除非明确了必须使用，否则孕妇不能应用比索洛尔。如果必须使用，应监测子宫胎盘血流量和胎儿的生长情况。一旦发现对孕妇和胎儿产生有害的作用，应该选择其他的治疗方法。必须对新生儿进行严密监测，出生后的前3日最易发生低血糖和心动过缓等症状。(3) 本品是否经人乳排泄尚不清楚，不建议哺乳期妇女使用。(4) 下列情况慎用，如支气管痉挛；与吸入型麻醉药合用；血糖浓度波动较大的糖尿病患者及酸中毒患者；严格禁食者；有严重过敏史，正在进行脱敏治疗；一度房室传导阻滞；变异性心绞痛；外周动脉阻塞型疾病；患有银屑病或有银屑病家族史的患者。嗜铬细胞瘤患者仅在使用肾上腺素α受体拮抗药后才能服用本品。(5) 尚无儿童应用本品的经验，因此儿童避免使用。(6) 老年患者用药时不需要调整剂量。(7) 使用本品可能掩盖甲状腺毒症的症状。(8) 由于本品的降压作用存在个体差异，应用本品可能会减弱患者驾车或操纵机器的能力，尤其在开始服药、增加剂量及与乙醇同服时更应注意。(9) 除非特别指明，否则使用本品时不得突然停药。

【禁忌证】对本品过敏，急性心力衰竭或处于心力衰竭失代偿期需用静脉注射

正性肌力药物治疗的患者，心源性休克，二度和三度房室传导阻滞，病窦综合征，窦房阻滞，心动过缓（心率＜每分钟60次），血压过低（收缩压＜100 mmHg），严重支气管哮喘或严重慢性梗阻性肺疾病，外周动脉阻塞性疾病晚期和雷诺综合征，未经治疗的嗜铬细胞瘤，代谢性酸中毒者。

【不良反应】可见轻度乏力，胸闷，头晕，心动过缓，嗜睡，心悸，头痛和下肢水肿，腹泻，便秘，恶心，腹痛，红斑，瘙痒，血压明显下降，脉搏缓慢或房室传导阻滞，麻刺感或四肢冰凉，肌肉无力，肌肉痛性痉挛及泪少，对伴有糖尿病的年老患者，其糖耐量可能降低，并掩盖低血糖表现。

【用法与用量】口服：①高血压或心绞痛，一次5 mg，一日1次，轻度高血压患者可以从2.5 mg开始治疗，可增至一次10 mg，一日1次。②慢性稳定性心力衰竭，一次1.25 mg，一日1次，每隔1周逐渐加量至5 mg，然后每隔4周逐渐加量至10 mg维持治疗，一日最大剂量为10 mg。

【制剂与规格】富马酸比索洛尔片：① 2.5 mg；② 5 mg。

富马酸比索洛尔胶囊：① 2.5 mg；② 5 mg。

倍他洛尔 [保（乙）]

Betaxolol

【适应证】用于高血压、心绞痛、心律失常（口服剂型）。

【注意事项】下列情况慎用，如孕妇及哺乳期妇女，哮喘，慢性阻塞性支气管病，心力衰竭，心动过缓，周围血管疾病，肺功能不全，甲状腺功能减退，糖尿病，治疗过的嗜铬细胞瘤性高血压，银屑病和有过敏史者停药时须经1～2周以上，逐渐减少剂量停药。

【禁忌证】对本品过敏者，支气管哮喘；严重慢性阻塞性肺疾病；明显心力衰竭；心源性休克；经治疗未能控制的心功能不全；心动过缓；严重的变异型心绞痛；低血压；严重的周围血管疾病；未经治疗的嗜铬细胞瘤性高血压。

【不良反应】疲乏，四肢冷，心率减慢，胃功能紊乱，性欲降低，心力衰竭，血压突然降低，支气管痉挛，低血糖，雷诺综合征，皮疹。

【用法与用量】口服，一次20 mg，一日1次。

【制剂与规格】盐酸倍他洛尔片：① 10 mg；② 20 mg；③ 40 mg。

拉贝洛尔 [保（乙）]

Labetalol

【适应证】用于各种类型高血压。

【注意事项】（1）孕妇忌用静脉注射，口服制剂可安全有效地用于妊娠高血压，不影响胎儿生长发育。（2）乳汁中的浓度为母体血液的22%～45%，哺乳期妇女慎用。忌静脉注射。（3）下列情况慎用，如有严重过敏史，慢性心力衰竭，糖尿病，甲状腺功能减退，肺气肿或非过敏性支气管炎，肝、肾功能不全，雷诺综合征或周围血管疾病者。（4）儿童安全性尚不明确，忌用静脉注射。（5）老年人用药生物利用度高，因此，可适当减少用药剂量。（6）少数患者可在服药后2～4小时出现直立性低血压，因此用药剂量应该逐渐增加。给药期间患者应保持仰卧位，用药后要平卧3小时。若降压过低，可用去氧肾上腺素或阿托品予以拮抗。（7）本品用量必须强调个体化，不同个体、不同疾病用量不尽相同，避免突然停药。（8）本品用于嗜铬细胞瘤的降压有效，但少数病例有血压反常升高的报道，故用药时应谨慎。

【禁忌证】病态窦房结综合征、心脏传导阻滞（二或三度房室传导阻滞）未经安装起搏器的患者、重度或急性心力衰竭、心源性休克患者、脑出血、支气管哮喘、对本品过敏者。

【不良反应】可见眩晕、乏力、幻觉、恶心、消化不良、腹痛、腹泻，口干、头皮麻刺感、心动过速、急性肾衰竭、瘙痒、乏力，胸闷、直立性低血压。

【用法与用量】（1）口服：一次100 mg，一日2～3次，2～3日后根据需要加量。常用维持量为一次200～400 mg，一日2次。饭后服。一日最大剂量2 400 mg。

(2) 注射：①静脉注射，一次25～50 mg，加10%葡萄糖注射液20 ml，于5～10分钟缓慢注射，如降压效果不理想可于15分钟后重复一次，直至产生理想的降压效果。总剂量不应超过200 mg。②静脉滴注，本品100 mg，加5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液250ml，以每分钟1～4 mg的速度滴注，取得较好效果后停止滴注，有效剂量为50～200 mg，但对嗜铬细胞瘤患者可能需300 mg以上。

【制剂与规格】盐酸拉贝洛尔片：①50 mg；②100 mg；③200 mg。

盐酸拉贝洛尔注射液：①2 ml：25mg；②5ml：50mg；③10ml：50mg。

注射用盐酸拉贝洛尔：①25 mg；②50 mg。

卡维地洛[保(乙)]

Carvedilol

【适应证】用于原发性高血压、有症状的心力衰竭。

【注意事项】(1) 密切监测肾功能，发生肾功能减退应减量或停药。(2) 用于妊娠妇女尚无足够的临床经验，β受体拮抗药降低胎盘灌注，可能会导致胎死宫内、流产和早产，对胎儿和新生儿也会发生副作用（特别是低血糖和心动过缓），还会增加新生儿发生心肺并发症的危险性，所以孕妇或有可能妊娠的妇女禁用。(3) 卡维地洛和（或）它的代谢产物可通过乳汁分泌，因此哺乳期妇女应避免使用，如需服用应停止母乳喂养。(4) 下列情况慎用，如糖尿病患者；伴有糖尿病的充血性心力衰竭患者；伴有低血压（收缩压< 100 mmHg）的充血性心力衰竭患者；有支气管痉挛倾向的患者、慢性阻塞性肺疾病患者，外周血管疾病的患者，变异性心绞痛患者。(5) 嗜铬细胞瘤患者使用卡维地洛前，应先使用α受体拮抗药。(6) 尚无18岁以下患者安全性及疗效的研究资料。(7) 老年人应用该药时，应从低剂量（10 mg）开始，并注意密切观察。手术患者使用卡维地洛要小心，因为卡维地洛与麻醉药有协同负性肌力作用及低血压等。

【禁忌证】(1) 对本品任何成分过敏者。(2) 纽约心脏病协会分级为Ⅳ级的失代偿性心力衰竭，需使用静脉正性肌力药的患者。(3) 哮喘患者、伴有支气管痉挛的慢性阻塞性肺疾病（COPD）患者。(4) 严重肝功能异常。(5) 二或三度房室传导阻滞、严重心动过缓（心率<每分钟50次）、病窦综合征（包括窦房阻滞）。(6) 心源性休克。(7) 严重低血压（收缩压< 85 mmHg）。(8) 手术前48小时内。

【不良反应】常见头晕、头痛、水肿、房室传导阻滞、心动过缓、低血压、使原有间歇性跛行或雷诺现象患者症状加重、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、便秘；偶见肾功能损害和肝功能异常；罕见过敏反应。

【用法与用量】口服：①有症状的充血性心力衰竭，起始剂量一次3.125 mg，一日2次，每隔2周渐增剂量直至一次25 mg，一日2次。剂量必须增加到患者能耐受的最高限度。体重< 85 kg者，一次最大剂量25 mg，一日2次；体重> 85 kg，一次最大剂量50 mg，一日2次。卡维地洛停药超过2周，再次用药方法同上。②高血压，开始2日一次12.5 mg，一日1次，以后一次25 mg，一日1次。最大剂量一日50 mg，分1～2次服用。

【制剂与规格】卡维地洛片：①3.125mg；②6.25mg；③10mg；④12.5mg；④20mg；⑤25 mg。

阿罗洛尔[保(乙)]

Arotinolol

【适应证】用于原发性高血压病（轻度至中度）、心绞痛、快速型心律失常、原发性震颤。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女应避免使用。(2) 下列情况慎用，如充血性心力衰竭、特发性低血糖、控制不充分的糖尿病患者、长时间禁食者、低血压、心动过缓、一度房室传导阻滞、末梢血循环障碍（雷诺综合征、间隙性跛行）、严重肝功能、肾功能障碍的患者、老年患者。(3) 老年人用药时应从小剂量（如一次5 mg）开始，慎重给药，老年患者一般不宜过度降压，且用药易引起血压过度下降和心动过缓，需停药时，应缓慢减量。

(4) 在用药期间，需定期检查心功能（心率、血压、心电图、X线片等）。尤其出现心动过缓及低血压时，须减量或停药，必要时使用阿托品。(5) 手术前48小时内不宜给药。(6) 有可能出现眩晕、站立不稳症状，提醒服用本药的患者（尤其是在服用初期）在驾驶汽车等伴有危险的机械作业中予以注意。(7) 用于嗜铬细胞瘤患者时，须始终联合应用 α 受体阻滞药。

【禁忌证】明显窦性心动过缓、二三度房室传导阻滞、窦房传导阻滞、病态窦房结综合征、糖尿病性酮症、代谢性酸中毒、有可能出现支气管哮喘或支气管痉挛、心源性休克、肺动脉高压所致右侧心力衰竭、充血性心力衰竭、未治疗的嗜铬细胞瘤、妊娠期妇女或有妊娠可能的妇女、对本药有过敏史者。

【不良反应】常见心动过缓、心悸、头痛、胸痛、头晕、失眠、乏力、腹痛、稀便、食欲缺乏、恶心、肝功能异常，尿素氮及肌酐升高，三酰甘油及尿酸升高，总胆固醇、空腹血糖值、CPK、白细胞升高等；偶见过敏反应。

【用法与用量】口服：(1) 原发性高血压（轻、中度）、心绞痛、快速型心律失常，一次10 mg，一日2次，根据患者年龄、症状等进行增减，最大剂量一日30 mg。(2) 原发性震颤，初始剂量，一次10 mg，一日1次，疗效不充分时，一次10 mg，一日2次。根据患者年龄、症状等进行增减，最大剂量为一日30 mg。

【制剂与规格】盐酸阿罗洛尔片：① 5 mg；② 10 mg。

艾司洛尔 [保（乙）]

Esmolol

【适应证】用于心房颤动、心房扑动时控制心室率，围手术期高血压，窦性心动过速。

【注意事项】(1) 肾衰竭患者半衰期延长，注意监测。(2) 老年人慎用。(3) 用药期间应定期监测血压、心率、心功能变化。(4) 高浓度给药（> 10 mg/ml）会造成严重的静脉反应，包括血栓性静脉炎，20 mg/ml 的浓度在血管外可造成严重的局部反应，甚至坏死，故应尽量经大静脉给药。(5) 糖尿病患者应用时应小心，本品可掩盖低血糖反应。

【禁忌证】支气管哮喘或有支气管哮喘病史、严重慢性阻塞性肺疾病、窦性心动过缓、二或三度房室传导阻滞、难治性心功能不全、心源性休克、对本品过敏者。

【不良反应】(1) 心血管系统：低血压、心动过缓、传导阻滞、外周灌注不足的症状。(2) 神经系统：头痛、头晕、嗜睡、乏力、惊厥等。(3) 呼吸、消化系统：气管痉挛、呼吸困难、消化不良、腹部不适、恶心、呕吐、便秘、口干等。(4) 注射部位发生炎症反应：水肿、红斑、烧灼感、血栓性静脉炎和外渗性皮肤坏死。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：(1) 心房颤动、心房扑动时控制心室率，成人，负荷量按体重每分钟0.5mg/kg，静脉注射约1分钟；维持量按体重每分钟0.05 mg/kg，静脉滴注，4分钟后若疗效理想则继续维持，若疗效不佳可重复给予负荷量并将维持量按每分钟0.05 mg/kg的幅度递增，维持量最大可加至每分钟0.3 mg/kg，但每分钟0.2 mg/kg以上的剂量并未带来明显的好处。(2) 围手术期高血压或心动过速，初始剂量按体重1 mg/kg，30秒内静脉注射，继续以1分钟0.15 mg/kg的速度静脉滴注，最大维持量为1分钟0.3 mg/kg，逐渐控制剂量，同室上性心动过速治疗。

【制剂与规格】盐酸艾司洛尔注射液：① 2 ml：0.2 g；② 10 ml:0.25 g；③ 10 ml：0.1 g。

索他洛尔 [保（乙）]

Sotalol

【适应证】用于各种危及生命的室性快速型心律失常。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如支气管痉挛性疾病的患者、不稳定型糖尿病患者或自发性低血糖患者、病态窦房综合征患者、心力衰竭患者在用洋地黄和（或）利尿药控制心功能不全后方可慎用本品、肾功能不全者、孕妇或哺乳期妇女、老年人。(2)用药期间检测血药浓度、血钾、血钙浓度及心电图等。本品所引起的严重心律失常多发生在开始用药的最初7日或

调整药物剂量后的最初3日，故患者宜住院观察。(3) 服用本品的患者突然停药可能出现冠状动脉供血不足，引起心绞痛或心律失常恶化，故长期服药的患者宜在1～2周逐渐减量，特别是伴有心肌缺血性疾病的患者，不应突然停药。(4) 避免与能延长QT间期的药物合用，当QT间期超过500毫秒时应酌情减量或停药。(5) 服用本品前应严密监测下停用其他抗心律失常药，一般停用时间至少为该药物血浆浓度半衰期的2～3倍。如停用药物为胺碘酮，则应待QT间期恢复正常时再给予本品。

【禁忌证】支气管哮喘、窦性心动过缓、二或三度房室传导阻滞（除非安放了心脏起搏器）、先天性或获得性心电图QT间期延长综合征、心源性休克、未控制的充血性心力衰竭及对本品过敏者。

【不良反应】可见低血压，支气管痉挛，疲倦，心动过缓（低于每分钟50次），呼吸困难，心律失常，乏力，眩晕，扭转性室性心动过速，多源性室性心动过速，心室颤动。

【用法与用量】(1) 口服：一次40～80 mg，一日2次。从小剂量开始，逐渐加量。室性心动过速，一日160～480 mg。(2) 静脉注射：推荐剂量按体重0.5～1.5 mg/kg，用5%葡萄糖20 ml稀释，10分钟内缓慢注射，如有必要可在6小时后重复。

【制剂与规格】盐酸索他洛尔片：① 40 mg；② 80 mg。

盐酸索他洛尔注射液：2 ml：20 mg。

注射用盐酸索他洛尔：40 mg。

噻吗洛尔 [基（基）, 保（甲）]

Timolol

【适应证】用于原发性开角型青光眼，高眼压症，闭角型青光眼的辅助治疗，手术后引起的高眼压反应，原发性高血压病，心绞痛或心肌梗死后的治疗，预防偏头痛。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者应减量。(2) 本品已在母乳中发现，由于在哺乳中本品严重不良反应的潜在性存在，哺乳期妇女慎用。以下情况慎用，如自发性低血糖患者及接受胰岛素或口服降糖药治疗的患者，不宜单独用于治疗闭角型青光眼，心功能损害者避免与钙通道阻滞药合用，心脑血管供血不足患者，轻中度慢性阻塞性肺病，支气管痉挛或有支气管痉挛病史的患者。(3) 应用本品滴眼时需定期复查观察眼压，根据眼压变动情况调整剂量。(4) 本品不宜单独用于治疗闭角型青光眼。与其他滴眼液联合使用时，请间隔10分钟以上。

【禁忌证】支气管哮喘或有支气管哮喘史者，严重慢性阻塞性肺疾病，窦性心动过缓，二或三度房室传导阻滞，心源性休克，难治性心力衰竭，对本品过敏者及小儿。

【不良反应】可见眼烧灼感及刺痛，心动过缓，头晕，重症肌无力的症状加重，感觉异常，嗜睡，失眠，噩梦，抑郁，精神错乱，幻觉，支气管痉挛，呼吸衰竭，呼吸困难，鼻出血，咳嗽，上呼吸道感染，掩盖糖尿病患者应用胰岛素或降糖药后的低血糖症状。

【用法与用量】(1) 口服：①高血压，初始剂量一次2.5～5 mg，一日2～3次，根据心率及血压变化增减剂量，维持量通常为一日20～40 mg，一日最大剂量60 mg。增加药物剂量的间期至少为7日。②心肌梗死，一次2.5 mg，一日2次，可渐增至一日20 mg。③偏头痛，一次10 mg，一日2次。根据临床反应及耐受性可渐增至一日30 mg，或减至一日10 mg。6～8周无效则应停用。(2) 滴眼：滴于眼睑内，一次1滴，一日1～2次，如眼压已控制，可改为一日1次。如原用其他药物，在改用本品治疗时，原药物不宜突然停用，应自滴用本品的第2日起逐渐停用（滴眼液）。对病情较重者，更应谨慎或遵医嘱。

【制剂与规格】噻吗洛尔片：① 5 mg；② 10 mg。

马来酸噻吗洛尔片：①2.5 mg；②5 mg。

马来酸噻吗洛尔滴眼液：① 0.4 ml：1 mg；② 0.5 ml：1.25 mg；③ 5 ml：12.5 mg；④ 5 ml：25 mg（以噻吗洛尔计，下同）。

马来酸右旋噻吗洛尔滴眼液：5 ml：50 mg。

马来酸噻吗洛尔眼用胶体溶液：

①2.5 ml：6.25 mg；②2.5 ml：12.5 mg；③5 ml：12.5 mg；④5 ml：25 mg。

4.8 钙通道阻滞药

4.8.1 二氢吡啶类

硝苯地平[基(基)，保(甲/乙)]

Nifedipine

【适应证】用于高血压，冠心病，心绞痛。

【注意事项】(1) 严重肝功能不全时减小剂量。(2) 老年人用药应从小剂量开始。(3) 严重主动脉瓣狭窄者慎用。(4) 终止服药应缓慢减量。(5) 影响驾车和操作机械的能力。(6) 不得与利福平合用。

【禁忌证】对硝苯地平过敏者，心源性休克，哺乳期妇女。

【不良反应】常见面部潮红、头晕、头痛、恶心、下肢肿胀、低血压、心动过速。较少见呼吸困难。罕见胸痛、晕厥、胆石症、过敏性肝炎。

【用法与用量】(1) 口服：①片剂、胶囊剂、胶丸。初始剂量一次 10 mg，一日 3 次，维持剂量一次 10～20 mg，一日 3 次；冠脉痉挛者可一次 20～30 mg，一日 3～4 次，单次最大剂量 30mg，一日最大剂量 120 mg。②缓释片剂、缓释胶囊剂。一次 10～20 mg，一日 2 次，单次最大剂量 40 mg，一日最大剂量 120 mg。③控释片剂，一次 30 mg，一日 1 次。缓控释制剂不可掰开或嚼服。(2) 静脉滴注：遮光，一次 2.5～5 mg，加入 5% 葡萄糖注射液 250 ml 稀释后在 4～8 小时缓慢滴入，最大剂量一日 15～30 mg，可重复使用 3 日，以后改为口服制剂。

【制剂与规格】硝苯地平片：①5 mg；②10 mg。

硝苯地平缓释片：①10 mg；②20 mg。

硝苯地平控释片：①30 mg；②60 mg。

硝苯地平胶囊：①5 mg；②10 mg。

硝苯地平缓释胶囊：20 mg。

硝苯地平胶丸：①5 mg；②10 mg。

硝苯地平注射液：5 ml：2.5 mg。

尼群地平[基(基)，保(甲)]

Nitrendipine

【适应证】用于高血压。

【注意事项】(1) 肝功能不全时慎用。(2) 肾功能不全对本品影响较小，但应慎用。(3) 本品在妊娠期妇女中应用的研究尚不充分，尚未发生问题，但应注意不良反应。(4) 老年人应减少剂量，服用 β 受体拮抗药者应慎重加用本品，并从小剂量开始，推荐老年人初始剂量为一日 10 mg。(5) 在用药期间须定期测量血压、心电图，少数接受 β 受体拮抗药者加用此药后出现心力衰竭，有主动脉瓣狭窄的患者危险性更大。

【禁忌证】对本品过敏，严重主动脉瓣狭窄。

【不良反应】较少见头痛，面部潮红；少见头晕，恶心，低血压，足踝部水肿，心绞痛发作；过敏者可见过敏性肝炎，皮疹，剥脱性皮炎。

【用法与用量】口服：初始剂量一次 10 mg，一日 1 次，以后可调整为一次 10 mg，一日 2～3 次或一次 20 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】尼群地平片：①12.5 mg；②25 mg。

尼群地平胶囊：10 mg。

尼群地平软胶囊：10 mg。

尼群地平贴片：50 mg。

尼莫地平[保(甲/乙)] 用于缺血性脑血管病、偏头痛、蛛网膜下腔出血所致脑血管痉挛，急性脑血管病恢复期的血液循环改善，突发性耳聋，轻中度高血压。口服：①急性脑血管病恢复期，一次 30～40 mg，一日 4 次。②缺血性脑血管病，普通制剂一日 30～120 mg，分 3 次服用，连续 1 个月。缓释制剂一次 60～120 mg，一日 2 次，连续 1 个月。③偏头痛：一次 40 mg，一日 3 次，12 周为 1 个疗程。④蛛网膜下腔出血所致脑血管痉挛，一次 40～60 mg，一日 3～4 次，3～4 周为 1 个疗程。⑤突发性聋，一日 40～60 mg，分 3 次服用，5 日为 1 个疗程，一般用药 3～4 个疗程。⑥轻中度高血压，一次 40 mg，

一日3次，一日最大剂量为240 mg。静脉注射：用于动脉瘤性蛛网膜下腔出血后脑血管痉挛引起的缺血性神经损伤。体重≤70 kg或血压不稳定，开始2小时0.5 mg/h，耐受良好，2小时后可增至1 mg/h；体重>70 kg，开始1 mg/h，耐受良好，2小时后可增至2 mg/h。（其他见1.1.1.4）

氨氯地平[保(乙)]

Amlodipine

【适应证】用于高血压，稳定型心绞痛，变异型心绞痛和经血管造影证实的冠心病。

【注意事项】(1) 与二氢吡啶类药物有交叉过敏。(2) 肝功能不全时半衰期延长，慎用。(3) 肾功能损害可采用正常剂量。(4) 孕妇只在非常必要时使用。(5) 尚不知本品能否通过乳汁分泌，服药的哺乳期妇女应中止哺乳。(6) 下列情况慎用，如心力衰竭者、严重肝功能不全。(7) 老年人宜从小剂量开始，逐渐增量。

【禁忌证】对二氢吡啶类药物或本品任何成分过敏者，重度主动脉瓣狭窄，严重低血压。

【不良反应】可见因血管扩张导致的头晕、头痛、潮红、低血压、心动过速、外周水肿（尤其是踝部）。较少见心悸、恶心及其他胃肠不适、精神抑郁。少见心绞痛、心动过缓、直立性低血压。过敏反应可见药疹、发热、肝功能异常。动物实验有致畸性。

【用法与用量】口服：初始剂量，一次5 mg，一日1次，最高剂量一次10 mg，一日1次。与其他抗高血压药合用时，一次2.5 mg，一日1次。

【制剂与规格】苯磺酸氨氯地平片：① 2.5 mg；② 5 mg；③ 10 mg（以氨氯地平计，下同）。

苯磺酸氨氯地平分散片：5 mg。

苯磺酸氨氯地平胶囊：5 mg。

马来酸氨氯地平片：5 mg。

甲磺酸氨氯地平片：5 mg。

L-门冬氨酸氨氯地平片：5 mg。

左旋氨氯地平[保(乙)]

Levamlodipine

【适应证】用于高血压，心绞痛。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如充血性心力衰竭、重度主动脉瓣狭窄者、肝功能不全。其余见氨氯地平。(2) 老年人宜从小剂量开始，逐渐增量。

【禁忌证】见氨氯地平。

【不良反应】本品能很好耐受，较少见头痛，水肿，疲劳，失眠，恶心，腹痛，面部潮红，心悸，头晕；极少见瘙痒，皮疹，呼吸困难，无力，肌肉痉挛，消化不良。

【用法与用量】口服：①高血压，初始剂量一次2.5 mg，一日1次，最大剂量一次5 mg，一日1次。虚弱或老年患者、伴有肝功能不全患者初始剂量一次1.25 mg，一日1次。②心绞痛：初始剂量一次2.5～5 mg，一日1次。

【制剂与规格】苯磺酸左旋氨氯地平片：2.5 mg。

马来酸左旋氨氯地平片：2.5 mg。

非洛地平[保(乙)]

Felodipine

【适应证】用于高血压，心绞痛。

【注意事项】(1) 肝功能不全时减小剂量，并注意监测血压。(2) 肾功能不全不需要调整剂量。(3) 可泌入乳汁，哺乳妇女停药或停止哺乳。(4) 老年人需减少剂量并注意监测。(5) 下列情况慎用，如低血压患者、肝肾功能不全、心功能不全。(6) 服药期间注意监测血压。

【禁忌证】对本品任何成分过敏；不稳定型心绞痛；失代偿性心力衰竭；急性心肌梗死；妊娠妇女。

【不良反应】常见头痛，皮肤潮红，周围性水肿；少见心动过缓，心悸，眩晕，感觉异常，恶心，腹痛，皮疹，瘙痒，疲劳；罕见晕厥，呕吐，关节痛，肌痛，性功能障碍，荨麻疹；非常罕见齿龈增生，牙龈炎，肝药酶增加，皮肤光敏反应，白细胞分裂性血管炎，尿频，过敏反应，血管水肿，发热。

【用法与用量】口服：初始剂量一次2.5 mg，一日2次；维持剂量一次5 mg或10 mg，一日1次；必要时可进一步增加剂量。缓释片及缓释胶囊，初始剂量一次5 mg，一日1次，维持剂量一次5 mg或10 mg，一日1次；可根据患者反应减少或增加剂量。本品不可掰开或嚼服。

【制剂与规格】非洛地平片：① 2.5 mg；② 5 mg；③ 10 mg。

非洛地平缓释片：① 2.5mg；② 5 mg；③ 10 mg。

非洛地平缓释胶囊：2.5 mg。

拉西地平［保（乙）］

Lacidipine

【适应证】用于高血压。

【注意事项】(1) 肝功能不全时慎用，需减小剂量，初始剂量一日1次2 mg。(2) 肾功能不全无须调整剂量。(3) 孕妇应权衡利弊，临娩妇女慎用。(4) 本品可分泌入乳，哺乳期妇女避免使用。(5) 下列情况慎用，如新发心肌梗死、不稳定型心绞痛、心脏储备力差、QT间期延长者。(6) 老年人初始剂量为一次2 mg，一日1次，必要时可增至一日4～6 mg，一日1次。

【禁忌证】对本品过敏；严重主动脉瓣狭窄；心源性休克；急性心肌梗死。

【不良反应】常见头痛，皮肤潮红，水肿，眩晕和心悸；少见无力，皮疹（包括红斑和瘙痒），胃肠道不适，恶心，多尿，肌肉痉挛，情绪障碍，心绞痛加重，齿龈增生。

【用法与用量】口服：初始剂量，一次4 mg，一日1次，晨服更佳；根据患者反应，3～4周后可加量至一次6～8 mg，一日1次。

【制剂与规格】拉西地平片：① 4mg；② 6 mg。

尼卡地平［保（乙）］

Nicardipine

【适应证】用于高血压，稳定型心绞痛，手术时异常高血压的急救处置及高血压急症（注射剂）。

【注意事项】(1) 严重肝功能不全时半衰期延长，可能需要减少剂量。(2) 中度肾功能不全时，小剂量开始使用。(3) 本品可分泌入乳，哺乳期妇女避免使用。(4) 下列情况慎用，如卒中史、主动脉瓣狭窄、心力衰竭、青光眼、急性脑梗死和脑缺血患者、孕妇和儿童。(5) 老年人应从低剂量开始。(6) 在用药期间应定期监测血压、心率、心电图。

【禁忌证】对本品过敏；颅内出血尚未完全止血；脑卒中急性期颅内压增高；重度主动脉瓣狭窄或二尖瓣狭窄；急性心功能不全，心源性休克。

【不良反应】常见足踝部水肿，头晕，头痛，面部潮红；另见心悸，心动过速，乏力，失眠，恶心，呕吐，便秘，腹泻，腹痛，食欲缺乏，皮疹，感觉异常，尿频，粒细胞减少，抑郁，阳痿，注射部位可出现疼痛、发红等。

【用法与用量】(1) 口服：初始剂量，一次20 mg，一日3次；维持剂量，一次20～40 mg，一日3次；增加剂量前至少连续给药3日以上。缓释片、缓释胶囊一次40 mg，一日2次。(2) 静脉滴注：用氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液稀释，配成浓度为0.01%～0.02%（1 ml中含盐酸尼卡地平0.1～0.2 mg）后使用。①手术时异常高血压的紧急处理，滴注速度为每分钟2～10μg/kg，根据血压调节滴注速度，必要时可增至每分钟10～30μg/kg。②高血压急症，滴注速度为每分钟0.5～6μg/kg，根据血压调节滴注速度。

【制剂与规格】盐酸尼卡地平片：10 mg（以盐酸尼卡地平计，下同）。

盐酸尼卡地平缓释片：① 20mg；② 40 mg。

盐酸尼卡地平缓释胶囊：40 mg。

注射用盐酸尼卡地平：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

盐酸尼卡地平注射液：① 2ml：2 mg；② 5 ml：5 mg；③ 10 ml：10 mg。

盐酸尼卡地平葡萄糖注射液：① 100 ml：10mg，葡萄糖5.5g；② 250ml：25 mg，葡萄糖12.5 g。

盐酸尼卡地平氯化钠注射液：① 100ml：10 mg，氯化钠0.9 g；② 100 ml：20 mg，氯化钠0.9 g。

乐卡地平[保(乙)]

Lercanidipine

【适应证】用于轻、中度原发性高血压。

【注意事项】(1) 轻度至中度肝肾功能不全需要适当调整剂量。(2) 孕妇、哺乳期妇女及儿童不宜服用。(3) 下列情况慎用，如行透析治疗、心脏病或需安装起搏器者。

【禁忌证】对二氢吡啶类过敏；左心室流出道梗阻；未控制的充血性心力衰竭；不稳定型心绞痛；严重肾脏或肝脏疾病；急性心肌梗死。

【不良反应】可见面部潮红，踝部水肿，心悸，心动过速，头痛，眩晕，胃肠道反应，皮疹，疲劳，嗜睡，肌痛，低血压。

【用法与用量】口服：餐前 15 分钟服用，一次 10 mg，一日 1 次，根据患者反应可增至一次 20 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】盐酸乐卡地平片：10 mg。

巴尼地平

Barnidipine

【适应证】用于原发性高血压、肾性高血压。

【注意事项】(1) 严重肝肾功能不全时慎用。(2) 哺乳期妇女应避免服用本品，必须服用时，应停止哺乳。(3) 老年人应从低剂量开始，密切观察。(4) 服用本品可影响驾车和机械操作的能力。(5) 停用本品应缓慢减量并注意观察。

【禁忌证】对本品过敏者，孕妇或可能妊娠的妇女禁用。

【不良反应】少见血尿酸、BUN、肌酐升高，恶心、呕吐、便秘，心悸，面部潮红，热感，头胀，水肿，乏力，胸闷，头痛，头重，眩晕，蹒跚感，皮疹，瘙痒感，皮肤发红，耳鸣，肌酸激酶升高；另外可见血压过低，心动过速，牙龈肥厚，过敏样症状，肝功能损害，黄疸。

【用法与用量】口服：早餐后服用，不可咬破或打开胶囊，初始剂量一次 10 mg，一日 1 次，维持剂量，一次 10 mg 或 15 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】盐酸巴尼地平缓释胶囊：① 10 mg；② 15 mg。

西尼地平[保(乙)]

Cilnidipine

【适应证】用于高血压患者的治疗。

【注意事项】(1) 下列患者不推荐使用：不稳定型心绞痛、未治疗的充血性心力衰竭以及 1 个月内曾发生心肌梗死者，儿童慎用。(2) 下列患者慎用：①曾有钙通道阻滞药导致严重不良反应者；②肝功能不全者；③慢性肾功能不全者；④充血性心力衰竭患者。(3) 对于老年患者不能过度降压，故应从低剂量开始，并注意观察患者用药后的反应。(4) 本品与 β 受体拮抗药合用时应谨慎，尤其是对左心室功能不全的患者更应注意。(5) 本品可引起血压过低等症状，故禁用于高空作业、驾驶车及操作机器等工作时。

【禁忌证】对本品及其中任何成分过敏者；妊娠及哺乳期妇女；对其他钙通道阻滞药过敏者；高度主动脉瓣狭窄的患者。

【不良反应】(1) 血液系统：可见血小板减少、白细胞计数和中性粒细胞异常等。(2) 心血管系统：可见心悸、胸痛、低血压、心电图异常等。(3) 神经系统：可有头痛、头晕、眩晕、嗜睡、失眠、手颤动、健忘等。(4) 消化系统：可见口渴、腹痛、腹胀、呕吐、便秘、黄疸及肝 ALT、AST 上升等肝功能异常。(5) 泌尿系统：可见尿频，尿酸、肌酸及尿素氮升高，尿蛋白及尿沉淀阳性等。(6) 过敏反应：表现为瘙痒、药疹、皮肤红肿等。(7) 其他：可有面色潮红、燥热、畏寒、水肿、味觉异常以及眼干燥、充血等；还可见胆固醇升高，尿糖阳性，血钾、血磷、血钙异常等。

【用法与用量】成年人的初始剂量为一次 5 mg，一日 1 次，早饭后服用。根据患者的临床反应，可将剂量增加，最大可增至一次 10 mg，一日 1 次，早饭后服用。

【制剂与规格】西尼地平片：① 5 mg；② 10 mg。

西尼地平胶囊：5 mg。

贝尼地平[保(乙)]

Benidipine

【适应证】用于原发性高血压。

【注意事项】(1) 严重肝功能不全、血压过低者慎用。(2) 老年人应从小剂量(一日 2 mg) 开始，并注意观察。(3) 停用本品应逐渐减量并注意观察，可因血压过度降低引起一过性意识消失、眩晕等。(4) 可影响驾车和机械操作的能力。

【禁忌证】对本品过敏、心源性休克，孕妇或可能妊娠的妇女、哺乳期妇女禁用。

【不良反应】见乐卡地平。

【用法与用量】口服：早餐后服用，一次 2 ~ 4 mg，一日 1 次，效果不佳时可增至一次 8 mg，一日 1 次。高龄患者初始剂量一次 2 mg，一日 1 次。重症高血压患者，一次 4 ~ 8 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】盐酸贝尼地平片：① 2 mg；② 4 mg；③ 8 mg。

4.8.2 非二氢吡啶类

维拉帕米[基(基)，保(甲/乙)] 见 4.2.2.4。

地尔硫䓬[保(乙)]

Diltiazem

【适应证】口服制剂用于冠状动脉痉挛引起的心绞痛，劳力型心绞痛，高血压，肥厚型心肌病；注射制剂用于室上性心动过速，手术时异常高血压的急救处置，高血压急症，不稳定型心绞痛。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全时需要减小剂量，慎用。(2) 可分泌入乳且近于血药浓度，必须使用时须停止哺乳。(3) 下列情况慎用，如充血性心力衰竭，心肌病，急性心肌梗死，心动过缓，一度房室传导阻滞，低血压，伴有预激综合征的房颤、房扑患者，正使用β受体拮抗药者。(4) 老年人应从低剂量开始。(5) 长期给药应定期监测肝肾功能。

【禁忌证】对本品过敏，病态窦房结综合征（未安起搏器)；二或三度房室传导阻滞（未安起搏器)；收缩压低于 90 mmHg；充血性心力衰竭；严重低血压；心源性休克；急性心肌梗死或肺充血；严重心肌病；心房扑动或心房颤动合并房室旁路通道；室性心动过速。

【不良反应】常见的不良反应有水肿，头痛，恶心，眩晕，皮疹，乏力。其他可见心绞痛，心律失常，房室传导阻滞、低血压、感觉异常、食欲缺乏、呕吐、腹泻。罕见急性肝损害，停药后可恢复。暂时性皮肤反应等。

【用法与用量】(1) 口服：①初始剂量，一次 30 mg，一日 4 次，餐前及睡前服药，每 1 ~ 2 日增加一次剂量。维持剂量，一日 90 ~ 360 mg。②缓释片、缓释胶囊，初始剂量，一次 60 ~ 120 mg，一日 2 次。维持剂量，一日 240 ~ 360 mg。本品不可掰开或嚼服。③控释胶囊，一次 90 ~ 150 mg，一日 1 次。本品不可掰开或嚼服。(2) 注射：注射用盐酸地尔硫䓬用 5 ml 以上的氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液溶解。①室上性心动过速，次静脉注射 10 mg，约 3 分钟缓慢静脉注射，根据情况适当增减。②手术时异常高血压的急救处置，次静脉注射 10 mg，1 分钟内缓慢静脉注射，根据情况适当增减；静脉滴注，每分钟 5 ~ 15 μg/kg，血压达目标值后，根据情况调节滴注速度。③高血压急症，静脉滴注，每分钟 5 ~ 15 μg/kg。血压达目标值后，根据情况调节滴注速度。④不稳定型心绞痛，静脉滴注，每分钟 1 ~ 5 μg/kg。从小剂量开始，根据情况增减，最大速度为每分钟 5 μg/kg。

【制剂与规格】盐酸地尔硫䓬片：30 mg。(以盐酸地尔硫䓬计，下同)。

盐酸地尔硫䓬缓释片：① 30 mg；② 60 mg；③ 90 mg。

盐酸地尔硫䓬缓释胶囊：① 60 mg；② 90 mg；③ 120 mg；④ 180 mg；⑤ 240 mg。

盐酸地尔硫䓬控释胶囊：① 90 mg；② 120 mg；③ 150 mg。

盐酸地尔硫䓬注射液：① 1ml : 10 mg；② 2ml : 10mg；③ 10ml : 10mg；④ 10 ml : 50 mg。

注射用盐酸地尔硫䓬：① 10mg；② 50mg。

4.9 肾素-血管紧张素-醛固酮系统药物

4.9.1 血管紧张素转换酶抑制药

血管紧张素转换酶抑制药（angiotension-converting enzyme inhibitor，ACEI）抑制血管紧张素Ⅰ转换成血管紧张素Ⅱ，同时还作用于缓激肽系统，抑制缓激肽降解，从而扩张血管，降低血压，减轻心脏后负荷，保护靶器官功能。常用的药物有卡托普利、依那普利、贝那普利、赖诺普利、雷米普利、培哚普利、福辛普利、咪达普利、西拉普利等。

（1）ACEI的适应证：主要用于高血压患者的降压治疗，尤其适用于糖尿病肾病的高血压治疗，可同时改善糖尿病患者多蛋白尿或微量蛋白尿，延缓肾脏损害。大量临床实践证实，ACEI可缓解慢性心力衰竭的症状，降低心力衰竭患者死亡率，改善预后，可预防或延缓临床心力衰竭的发生和发展。因此，我国及欧美指南都明确提出，全部心力衰竭患者，包括无症状患者，除非有禁忌证或不能耐受，均需终身应用ACEI。急性心肌梗死早期或后期用ACEI可减少心血管事件。ACEI对稳定型心绞痛治疗，可减少心肌梗死及脑卒中事件。

（2）应用ACEI时应注意：①首剂低血压反应。对已接受多种或大剂量利尿药（如呋塞米一日80 mg），伴低钠血症，脱水、低血容量，严重心力衰竭的患者在首剂治疗时可能出现低血压。对周围血管病，无症状肾血管病，已知的肾血管病首剂也可引起低血压。②用前和使用中应监测肾功能。③严重主动脉缩窄，肥厚型心肌病应慎用。④有特发性血管神经水肿应避免应用。⑤哺乳期应慎用，可能对婴儿不利。⑥偶可引起粒细胞缺乏症。⑦过敏反应，严重可出现血管神经性水肿，表现为喉头和皮下水肿，喉头痉挛，呼吸困难，需要积极处理。

（3）ACEI的禁忌证：妊娠、高钾血症、双侧肾动脉狭窄、有血管神经性水肿史者。

（4）ACEI的主要不良反应：长期干咳，皮疹，上呼吸道症状（鼻炎），明显的低血压和肾脏损害，消化道症状（恶心、呕吐、腹泻、腹痛）。肝功能损害，高钾血症，血钠降低，血液异常（粒细胞减少），头痛，头晕，乏力，味觉异常等。偶见血管神经性水肿。

卡托普利[基(基)，保(甲)]

Captopril

【适应证】用于高血压，心力衰竭，高血压急症。

【注意事项】（1）肾功能不全时谨慎使用并监测；更易出现高钾血症或其他不良反应。初始剂量为一次12.5 mg，一日2次。（2）可分泌入乳，哺乳期妇女需权衡利弊。（3）下列情况慎用，如自身免疫性疾病如严重系统性红斑狼疮，骨髓抑制，脑动脉或冠状动脉供血不足，血钾过高，肾功能不全，主动脉瓣狭窄，严格饮食限制钠盐或进行透析者。（4）儿童仅限于其他降压治疗无效时。（5）老年人对降压作用较敏感，应用本品须酌减剂量。（6）在用药期间，应定期监测白细胞计数和分类计数，最初3个月每2周查一次，每月查一次尿蛋白。（7）食物可使本品吸收减少30%～40%，宜在餐前1小时服药。（8）本品可使血尿素氮、肌酐浓度增高，常为暂时性，在有肾病或长期严重高血压而血压迅速下降后易出现，偶有血清ALT和AST增高。(9)可能增高高钾血症，与保钾利尿药合用时尤应注意检查血钾。（10）用本品时如蛋白尿逐渐增多，暂停本品或减少用量。(11)若白细胞计数过低，暂停用本品，可以恢复。（12）出现血管神经水肿，应停用本品，迅速皮下注射1∶1 000肾上腺素0.3～0.5 ml。（13）本品可引起尿丙酮检查假阳性。

【禁忌证】对本品或其他血管紧张素转换酶抑制药过敏；双侧肾动脉狭窄；有血管神经性水肿史；妊娠期妇女。

【不良反应】常见皮疹，心悸，心动过速，胸痛，咳嗽，味觉迟钝；少见蛋白尿，眩晕，头痛，晕厥，血管性水肿，心律失常，面部潮红或苍白，白细胞与粒细胞减少。

【用法与用量】（1）口服：①成人常用量。高血压，初始剂量一次12.5 mg，一日2～3次，按需要1～2周增至一次50 mg，一日2～3次。心力衰竭，初始

剂量一次 12.5 mg，一日 2～3 次，根据耐受情况逐渐增至一次 50 mg，一日 2～3 次，近期大量服用利尿药者初始剂量一次 6.25 mg，一日 3 次。②儿童常用量，降压与治疗心力衰竭，初始剂量，按体重一次 0.3 mg/kg，一日 3 次，必要时每 8～24 小时增加 0.3 mg/kg。(2) 静脉注射：需个体化给药，常用量，一次 25 mg，溶于 10% 葡萄糖注射液 20 ml，缓慢静脉注射 10 分钟，随后用 50 mg 溶于 10% 葡萄糖注射液 500 ml，静脉滴注 1 小时。

【制剂与规格】卡托普利片：①12.5mg；②25mg。

卡托普利胶囊：25 mg。

卡托普利滴丸：6.25 mg。

卡托普利注射液：①1 ml：25 mg；②2 ml：50 mg。

注射用卡托普利：①12.5mg；②25mg；③50 mg。

依那普利[基(基)，保(甲)]

Enalapril

【适应证】用于原发性高血压，肾性高血压，心力衰竭。

【注意事项】(1) 肝功能不全时应密切监测肝功能。(2) 肾功能不全时谨慎使用并监测；更易出现高钾血症或其他不良反应；肌酐清除率＜每分钟 30 ml 时起始剂量为一次 2.5 mg，一日 1 次。(3) 下列情况慎用，如主动脉瓣狭窄、肥厚型心肌病、哺乳期妇女。(4) 儿童无须调整剂量。新生儿和肾小球滤过率＜每分钟 30ml 的儿童患者中不推荐使用。(5) 在用药期间，应定期监测白细胞计数和肾功能。(6) 接受本品治疗在用高流量透析膜(如 AN69) 进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。

【禁忌证】对本品过敏；双侧肾动脉狭窄；有血管神经性水肿史。

【不良反应】常见头晕，头痛，疲乏，咳嗽；少见肌肉痉挛，口干，恶心，呕吐，腹泻，便秘，消化不良，心悸，心动过速，阳痿，直立性低血压，失眠，神经过敏，感觉异常，皮疹；罕见血管神经性水肿，男子女性型乳房。

【用法与用量】口服：①原发性高血压，初始剂量一次 5～10 mg，一日 1 次。维持剂量一次 10～20 mg，一日 1 次，最大剂量一日 40 mg，分 1～2 次服。②肾性高血压，初始剂量，一次 5 mg 或以下，一日 1 次，根据需要调整剂量。服用利尿药时应提前 2～3 日停用利尿药，或减小初始剂量。③心力衰竭，初始剂量，一次 2.5 mg，一日 1 次，并密切监测反应，根据耐受情况逐渐加量至一日 5～20 mg，分 1～2 次服。

【制剂与规格】马来酸依那普利片：①2.5mg；②5mg；③10mg。

马来酸依那普利胶囊：①5 mg；②10 mg。

马来酸依那普利叶酸片：①马来酸依那普利 10 mg，叶酸 0.8 mg；②马来酸依那普利 10 mg，叶酸 0.4 mg；③马来酸依那普利 5 mg，叶酸 0.4 mg。通常起始剂量为一日 5 mg/0.4 mg，根据患者的反应调整给药剂量，或遵医嘱。肝、肾功能异常患者和老年患者酌情减量或遵医嘱。

贝那普利[保(乙)]

Benazepril

【适应证】用于高血压，充血性心力衰竭。

【注意事项】(1) 肝功能不全时应密切监测肝功能。(2) 肾功能不全时慎用并监测，易出现高钾血症或其他不良反应；肌酐清除率＜每分钟 30 ml 时，起始剂量为一日 1 次 5 mg。(3) 妊娠期妇女不宜使用。可能造成羊水过少或造成胎儿及新生儿低血压，肾功能受损，头颅畸形。(4) 可分泌入乳，能达到婴儿体循环的贝那普利可忽略不计，但不建议哺乳期服用本药。(5)下列情况慎用，如主动脉瓣狭窄、二尖瓣狭窄。(6) 老年患者伴有心力衰竭、冠状动脉及脑动脉硬化患者使用时均应注意。(7) 用药期间应监测患者肝功能，极少发生肝炎和肝衰竭。(8) 接受本品治疗在用高流量透析膜(如 AN69) 进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。

【禁忌证】对本品过敏；双侧肾动脉狭窄；有血管神经性水肿史。

【不良反应】见卡托普利。

【用法与用量】口服：①高血压，初

始剂量一次10 mg，一日1次，疗效不佳时可加至一日20 mg，最大剂量为一次40 mg，一日1次。服用利尿药时，提前2～3日停用利尿药或减小初始剂量至一次5 mg，一日1次。②心力衰竭，初始剂量，一次2.5 mg，一日1次，并严密监测反应，根据耐受情况逐渐加量至一次5～20 mg，一日1次。

【制剂与规格】盐酸贝那普利片：① 5 mg；② 10 mg。

赖诺普利[保(乙)]

Lisinopril

【适应证】用于高血压，充血性心力衰竭，急性心肌梗死。

【注意事项】(1) 肾功能不全时谨慎使用并监测；易出现高钾血症或其他不良反应；肌酐清除率为每分钟31～70 ml时初始剂量为一日1次5～10 mg，肌酐清除率为每分钟10～30 ml时，初始剂量为一日1次2.5～5 mg，肌酐清除率＜每分钟10 ml时，初始剂量为一日1次2.5 mg，最大剂量为一日1次40 mg。(2) 妊娠期妇女不宜使用。(3) 哺乳期妇女避免使用。(4) 下列情况慎用，如肾功能损害、急性心肌梗死。(5) 老年人按肾功能及血压控制情况调整剂量。(6) 接受本品治疗在用高流量透析膜（如AN69）进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。

【禁忌证】对本品过敏，有血管神经性水肿史；双侧肾动脉狭窄。

【不良反应】常见头痛、头晕、疲乏、嗜睡、恶心、咳嗽；可见低血压、心悸、周围性水肿、皮疹、胃炎、便秘、焦虑、失眠、关节及肌肉痛、哮喘、血管神经性水肿及肾损害。

【用法与用量】口服：①高血压，初始剂量，一次10 mg，一日1次，维持剂量，一次20～40 mg，一日1次，最大剂量，一次80 mg，一日1次。服用利尿药时提前2～3日停用利尿药或减小初始剂量，至一次5 mg，一日1次。②心力衰竭，初始剂量一次2.5 mg，一日1次，根据耐受性逐渐加量至一次5～20 mg，一日1次。③急性心肌梗死，首剂5 mg，24小时及48小时后再分别给予5 mg和10 mg，此后一次10 mg，一日1次；收缩压＜120 mmHg或心肌梗死后3日内给予较低量一次2.5 mg，一日1次。用药应持续6周，出现心力衰竭症状时应继续使用。

【制剂与规格】赖诺普利片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

赖诺普利胶囊：① 5 mg；② 10 mg。

雷米普利[保(乙)]

Ramipril

【适应证】用于原发性高血压；充血性心力衰竭；急性心肌梗死（2～9日）后出现的轻到中度心力衰竭（NYHA Ⅱ级和Ⅲ级）；非糖尿病肾病；在心血管危险增加的患者降低心肌梗死、脑卒中或者心血管死亡的可能性。

【注意事项】(1) 肝功能不全时应密切监测肝功能。(2) 肾功能不全时谨慎使用并监测；更易出现高钾血症或其他不良反应。初始剂量为一日1次1.25 mg。(3) 同时使用利尿药，有充血性心力衰竭或肝肾功能不全的老年患者应慎用本品，使用本品时应根据血压控制的需要仔细调节用药剂量。(4) 下列情况慎用，如电解质紊乱、免疫反应紊乱或结缔组织病、全身应用免疫抑制药物。(5) 在较高肾素-血管紧张素系统活性患者中第一次使用需密切监测，以防发生急性血压下降；治疗期间发生血管神经性水肿，必须立即停药。(6) 接受本品治疗在用高流量透析膜（如AN69）进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。

【禁忌证】对本药或其他ACEI过敏；有血管神经性水肿史；双侧肾动脉狭窄；肾移植后；主动脉或二尖瓣狭窄；肥厚型心肌病；原发性醛固酮增多症；妊娠、哺乳期妇女及儿童。

当雷米普利用于急性心肌梗死后轻到中度心力衰竭时，有额外的禁忌证：持续的低血压（收缩压＜90 mmHg）、直立性低血压（坐位1分钟后收缩压降低≥20 mmHg）、严重心力衰竭（NYHA Ⅳ）、不稳定型心绞痛、致命的室性心律失常、肺源性心脏病。由于缺乏治疗经验，雷米

普利不能用于下列情况，如正接受甾体、非甾体抗炎药物，免疫调节剂和（或）细胞毒化合物治疗的肾病，透析，原发性肝脏疾病或肝功能损害，未经治疗的、失代偿性心力衰竭。

【不良反应】见卡托普利。

【用法与用量】口服：①高血压，初始剂量一次 2.5 mg，一日 1 次，晨服。根据需要 3 周后增加剂量，维持剂量一次 2.5 ~ 5 mg，一日 1 次，最大剂量为一日 10 mg。②急性心肌梗死后（2 ~ 9 日）轻到中度心力衰竭（NYHA Ⅱ级和Ⅲ级），初始剂量为一日 1.25 ~ 2.5 mg，分 2 次服用。间隔 1 ~ 2 日剂量可加倍，最大剂量一日 5 mg，分 2 次服用。③非糖尿病肾病，初始剂量，一次 1.25 mg，一日 1 次，2 ~ 3 周后剂量加倍，维持剂量一日 5 mg，肌酐清除率＜每分钟 60 ml 时，最大剂量为一日 5 mg。④心脑血管疾病二级预防，初始剂量，一次 2.5 mg，一日 1 次，1 周后剂量加倍，3 周后维持剂量一日 10 mg。⑤服用利尿药时，应提前 2 ~ 3 日停用或减少利尿药并减小初始剂量。

【制剂与规格】雷米普利片：①1.25mg；②2.5 mg；③5 mg；④10 mg。

培哚普利[保(乙)]

Perindopril

【适应证】用于高血压，充血性心力衰竭。

【注意事项】(1) 肝功能不全时应密切监测肝功能。(2) 肾衰竭患者应降低剂量，定期监测血钾和血肌酐水平。(3) 妊娠早期不推荐使用，妊娠中、晚期（4 ~ 9 个月）时禁用。(4) 以下情况慎用，如动脉硬化、严重心力衰竭（心功能Ⅳ级）、胰岛素依赖型糖尿病。老年人开始治疗之前，应检查肾功能和血钾。起始剂量应根据血压变化进行调整，在有水钠丢失的病例则更应谨慎，以免引起血压突然下降。(5) 接受本品治疗在用高流量透析膜（如 AN69）进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。

【禁忌证】对本品过敏；双侧肾动脉狭窄；有血管神经性水肿史；妊娠 4 ~ 9 个月孕妇；哺乳期妇女；先天性半乳糖血症、葡萄糖和半乳糖吸收障碍综合征、缺乏乳糖酶的患者。

【不良反应】可见头痛，疲倦，眩晕，情绪或睡眠紊乱，痛性痉挛，低血压，皮疹，胃痛，食欲缺乏，恶心，腹痛，味觉异常，干咳，血管神经性水肿，蛋白尿，高钾血症。

【用法与用量】口服：餐前服用。①原发性高血压，一次 4 mg，一日 1 次，酌情在 3 ~ 4 周逐渐增量，最大剂量一次 8 mg，一日 1 次。②肾性高血压，初始剂量，一次 2 mg，一日 1 次，后根据病情调整剂量。③充血性心力衰竭，初始剂量，一次 2 mg，一日 1 次，维持剂量，一次 2 ~ 4 mg，一日 1 次；严重心力衰竭，初始剂量，一次 1 mg，一日 1 次。④服用利尿药时应提前 2 ~ 3 日停用利尿药或减小初始剂量，至一次 2 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】培哚普利片（以培哚普利叔丁胺盐计）：① 2 mg；② 4 mg。

福辛普利[保(乙)]

Fosinopril

【适应证】用于高血压，心力衰竭。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如自身免疫性疾病、骨髓抑制、脑或冠状动脉供血不足、血钾过高、肾功能障碍、肝功能障碍、严格饮食限制钠盐或进行透析治疗者。(2) 不推荐用于儿童患者。(3) 老年患者不需要降低剂量。(4) 在用药期间随访检查。对有肾功能障碍或有白细胞缺乏的患者，最初 3 个月内每 2 周检查白细胞计数及分类计数 1 次，此后定期检查；尿蛋白检查，每月 1 次。(5) 本品的降压作用在立位与卧位相同。对原用利尿药治疗者，开始用本品前停用利尿药 2 ~ 3 日，但严重或恶性高血压例外，此时用本品小剂量，在观察下小心增加剂量。(6) 接受本品治疗在用高流量透析膜（如 AN69）进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。

【禁忌证】对本品过敏；双侧肾动脉狭窄；有血管神经性水肿史；妊娠期和哺乳期妇女。

【不良反应】常见头痛，头晕，疲乏，嗜睡，恶心，咳嗽；少见症状性低血压，直立性低血压，晕厥，心悸，周围性水肿，

皮疹，皮炎，便秘，胃炎，焦虑，失眠，感觉异常，关节痛，肌痛，哮喘。罕见血管神经性水肿。

【用法与用量】口服：①高血压，初始剂量，一次 10 mg，一日 1 次，4 周后根据需要加量，维持剂量一日 10 ~ 40 mg。同时服用利尿药时提前 2 ~ 3 日停用利尿药或在给予本品后监测几小时直至血压稳定。②心力衰竭，初始剂量，一次 10 mg，一日 1 次，并严密监测反应，根据耐受情况逐渐加量至一次 20 ~ 40 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】福辛普利钠片：①10mg；② 20 mg；③ 40 mg。

咪达普利[保(乙)]

Imidapril

【适应证】用于原发性高血压，肾实质性病变所致继发性高血压。

【注意事项】(1) 肾功能不全时谨慎使用并监测；更易出现高钾血症或其他不良反应。初始剂量，为一日 1 次 2.5 mg，肌酐清除率小于每分钟 30 ml 时用药需慎重，或剂量减半、或延长用药间隔。(2) 哺乳期妇女慎用本药，必须用药时，终止哺乳。(3)老年人从低剂量开始(如 2.5 mg)，边观察患者状态边慎重用药。(4) 下列情况慎用，如严重肾功能障碍、双侧肾动脉狭窄或单侧肾动脉狭窄、脑血管障碍及高龄患者、肝功能不全。(5) 重症高血压患者、行血液透析、服用利尿药的患者、进行低盐疗法的较严重患者须从小剂量开始用药。(6)手术前 24 小时内最好不用本药。(7) 伴有 1 型糖尿病患者用药初期可能出现肾功能迅速恶化和高钾血症，须监测血清肌酐值和血清钾值，如发现肾功能迅速恶化和血清钾值上升，需减量或终止给药。

【禁忌证】对本品过敏；有血管神经性水肿史；双侧肾动脉狭窄；妊娠或可能妊娠的妇女；用葡萄糖硫酸纤维素吸附器进行治疗的患者；用丙烯腈甲烯丙基磺酸钠膜（AN69）进行血液透析的患者。

【不良反应】见卡托普利。

【用法与用量】口服：一次 5 ~ 10 mg，一日 1 次，严重高血压及肾实质性病变继发性高血压初始剂量，为一次 2.5 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】盐酸咪达普利片：① 2.5 mg；② 5 mg；③ 10 mg。

西拉普利[保(乙)]

Cilazapril

【适应证】用于原发性高血压，肾性高血压，慢性心力衰竭。

【注意事项】(1) 肾功能不全时谨慎使用并监测，可根据患者的肌酐清除率而减少剂量；更易出现高钾血症或其他不良反应。(2) 哺乳期妇女避免使用。(3) 对使用较大剂量利尿药的老年慢性心力衰竭患者开始使用应严格按推荐的 0.5 mg 起始剂量用药。(4) 用药期间偶见症状性低血压。急性低血压患者必须平卧休息，必要时静脉滴注氯化钠注射液或扩容药。血容量恢复后，也可以继续本品治疗，但如低血压持续存在，则应减少剂量或中止用药。用于单侧或双侧肾动脉狭窄患者时，可能会使血尿素氮和血肌酐增加。(5) 与具降压作用的外科麻醉药合用时，能导致动脉性低血压，应以静脉输液法扩大血容量。无效时，应静脉滴注血管紧张素Ⅱ。接受本品治疗在用高流量透析膜（如 AN69）进行血液透析时有较高的类过敏反应发生率。在用硫酸聚糖吸收 LDL 时、脱敏治疗时（膜翅目毒素）也发生类过敏反应。

【禁忌证】对本品过敏；双侧肾动脉狭窄；腹水；主动脉瓣狭窄；心脏流出道阻塞；孕妇。

【不良反应】可见头痛，头晕，乏力，低血压，消化不良，恶心，皮疹，干咳，血管神经性水肿。

【用法与用量】口服：①原发性高血压，初始剂量一次 1 mg，一日 1 次，维持剂量一次 2.5 ~ 5.0 mg，一日 1 次。服用利尿药时，提前 2 ~ 3 日停用利尿药并减少初始剂量，至一次 0.5 mg，一日 1 次。②肾性高血压，初始剂量一次 0.25 ~ 0.5 mg，一日 1 次，维持剂量按个体调整。③慢性心力衰竭，初始剂量一次 0.5 mg，一日 1 次，根据病情逐渐增至一次 1 ~ 2.5 mg，一日 1 次，最大剂量为一次 5 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】西拉普利片：2.5 mg。

4.9.2 血管紧张素受体拮抗药

血管紧张素受体拮抗药（Angiotension receptor antagonist，ARB）是一类抗高血压药，阻断肾素-血管紧张素-醛固酮系统，克服了ACEI可能产生干咳等不良反应，更具特异性，故有较好安全性和耐受性更好。

目前国内已有氯沙坦、缬沙坦、厄贝沙坦、替米沙坦、坎地沙坦、奥美沙坦等，以及ARB复方制剂，如氯沙坦／氢氯噻嗪、厄贝沙坦／氢氯噻嗪、缬沙坦／氢氯噻嗪片等。

ARB通过拮抗血管紧张素Ⅱ与AT1受体结合、松弛血管平滑肌、对抗醛固酮分泌、减少水钠潴留、阻止成纤维细胞的增殖和内皮细胞凋亡，从而达到平稳有效降压、逆转心肌肥厚、减轻心力衰竭以及预防心房颤动电重构、改善高血压患者胰岛素抵抗、促进尿酸的排泄，从而显著降低心脏和脑卒中血管事件发生的危险。特别适合于不能耐受服ACEI而咳嗽的高血压患者。

ARB的适应证、禁忌证与ACEI基本相同。

氯沙坦[保（乙）]

Losartan

【适应证】用于原发性高血压。

【注意事项】(1) 肝硬化患者氯沙坦的血浆浓度明显增加，对肝功能不全患者应该考虑使用较低剂量。(2) 妊娠期妇女在妊娠中期和后期用药时，可引起正在发育的胎儿损伤，甚至死亡。(3) 哺乳期妇女停止哺乳或停用药物。(4) 以下情况慎用，如血管容量不足的患者；肾功能不全肾功能依赖于肾素-血管紧张素-醛固酮系统活性的患者（如严重的充血性心力衰竭患者）；双侧肾动脉狭窄或只有单侧肾脏而肾动脉狭窄的患者。(5) 已在1个月至16岁的儿童中建立本品抗高血压的应用，不推荐肾小球滤过率＜每分钟30 ml和肝脏受损的儿童使用本品。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者禁用。

【不良反应】可见乏力，胸痛，水肿；心悸，心动过速；腹痛，腹泻，消化不良，恶心、食欲缺乏；背痛，肌肉痉挛；头晕，头痛，失眠；咳嗽，鼻充血；偶有面部水肿，发热，直立性低血压，晕厥，心绞痛，二度房室传导阻滞，心肌梗死，心律失常，焦虑，共济失调，脱发，皮炎，光敏感，瘙痒，皮疹，荨麻疹，视物模糊，阳痿。大剂量应用可引起高钾血症。

【用法与用量】口服：一次50 mg，一日1次。部分患者剂量可增加到一次100 mg，一日1次。血管容量不足的患者，初始剂量，一次25 mg，一日1次。氯沙坦钾氢氯噻嗪，一日1次，一次1片。对反应不足的患者，剂量可增加至一日1次，一次2片，此剂量为一日最大服用剂量。本品可与食物同服或单独服用。

【制剂与规格】氯沙坦钾片：①50 mg；② 100 mg。

氯沙坦钾胶囊：50 mg。

氯沙坦钾氢氯噻嗪片：氯沙坦钾50 mg、氢氯噻嗪12.5 mg（常用起始剂量为一次1片，一日1次。反应不足时可增至最大剂量一次2片，一日1次）。

氯沙坦钾氢氯噻嗪片：氯沙坦钾50 mg、氢氯噻嗪12.5 mg。

缬沙坦[保（乙）]

Valsartan

【适应证】用于轻、中度原发性高血压。

【注意事项】(1) 肝功能不全时不需要调整剂量，胆道梗阻患者因排泄减少使用时应小心。(2) 肾功能不全时不需要调整剂量，但肌酐清除率＜每分钟10 ml时需要注意。(3) 哺乳妇女不宜使用。(4) 低钠及血容量不足患者注意避免出现低血压。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者，孕妇。

【不良反应】少见直立性血压改变；偶见轻度头痛，头晕，疲乏，腹痛，干咳，血钾增高，中性粒细胞减少，血红蛋白和血细胞比容降低，血肌酐和转氨酶增高；有腹泻，鼻炎，咽炎，关节痛，恶心。

【用法与用量】口服：一次80 mg，一日1次。降压不佳者，一次160 mg，一日1次，或加用利尿药。缬沙坦氢氯噻嗪，一次1片(80 mg/12.5 mg)，一日1次。

【制剂与规格】缬沙坦胶囊：① 40 mg；② 80 mg；③ 160 mg。

缬沙坦片：40 mg。

缬沙坦分散片：① 40 mg；② 80 mg。

缬沙坦氢氯噻嗪胶囊：缬沙坦 80 mg、氢氯噻嗪 12.5 mg。

缬沙坦氢氯噻嗪片：缬沙坦 80 mg、氢氯噻嗪 12.5 mg。

厄贝沙坦[保(乙)]

Irbesartan

【适应证】用于原发性高血压。

【注意事项】(1) 肾功能损害患者无须调整剂量；进行血液透析的患者，初始可考虑使用低剂量（75 mg），并定期监测血清钾和肌酐。(2) 妊娠的前 3 个月最好不使用本品。(3) 以下情况慎用，如血容量不足患者，肾血管性高血压，主动脉和二尖瓣狭窄，肥厚型梗阻性心肌病。(4) 不推荐原发性醛固酮增多症的患者使用本品。(5) 本品用于儿童的安全性和疗效尚未建立。(6) 尽管 75 岁以上老年人可考虑起始剂量为 75 mg，但通常对老年人不需要调整剂量。(7) 肾功能损害和肾脏移植患者推荐对血清钾和肌酐进行监测，无近期肾脏移植患者使用的经验。

【禁忌证】对本品过敏；妊娠 4 ~ 9 个月及哺乳期妇女。

【不良反应】常见眩晕，呕吐，疲劳，直立性眩晕，直立性低血压；偶见心动过速，潮红，咳嗽，腹泻，消化不良，胃灼热，性功能障碍，胸痛；罕见皮疹，荨麻疹，血管神经性水肿，高钾血症，头痛，耳鸣，味觉缺失，肝功能异常，肝炎，肌痛，关节痛，肾功能损害。

【用法与用量】口服：初始剂量，一次 150 mg，一日 1 次。根据病情可增至一次 300 mg，一日 1 次。进行血液透析和年龄超过 75 岁的患者，初始剂量一次 75 mg，一日 1 次。单独使用氢氯噻嗪或厄贝沙坦 150 mg 不能有效控制血压的患者，可用厄贝沙坦氢氯噻嗪 150 mg/12.5 mg 复方，一日 1 次。单独使用厄贝沙坦 300 mg 或使用 150 mg/12.5 mg 复方不能有效控制血压的患者可用本品 300 mg/12.5 mg（复方），一日 1 次。空腹或进餐时使用。不推荐一日剂量 > 300 mg/25 mg。必要时，本品可以合用其他抗高血压药。

【制剂与规格】厄贝沙坦片：① 75mg；② 150 mg；③ 300 mg。

厄贝沙坦分散片：75 mg。

厄贝沙坦胶囊：① 75 mg；② 150 mg。

厄贝沙坦氢氯噻嗪胶囊：内含厄贝沙坦 150 mg、氢氯噻嗪 12.5 mg。

厄贝沙坦氢氯噻嗪片：①内含厄贝沙坦 150 mg、氢氯噻嗪 12.5 mg；②内含厄贝沙坦 300 mg、氢氯噻嗪 12.5 mg。

坎地沙坦[保(乙)]

Candesartan

【适应证】用于原发性高血压。

【注意事项】(1) 对于肝功能不全的患者有可能使肝功能恶化，本品的清除率可能降低，应从小剂量开始服用，慎用。(2) 对于有肾功能不全的患者，由于过度降压，有可能使肾功能恶化，因此用药从一次 2 mg，一日 1 次开始服用，慎用。(3) 哺乳期妇女避免用药，必须服药时，应停止哺乳。(4) 以下情况慎用，如双侧或单侧肾动脉狭窄患者；高钾血症患者；肝功能不全患者；有药物过敏史的患者；老年患者。(5) 以下患者应该从小剂量开始，增加剂量时应监测患者，缓慢进行：进行血液透析的患者，严格进行限盐疗法的患者，服用利尿降压药的患者，低钠血症，肾功能不全患者，心力衰竭患者。(6) 手术前 24 小时最好停止服用。

【禁忌证】对本品过敏；妊娠或可能妊娠的妇女；严重肝功能不全；肾功能不全；胆汁淤滞患者。

【不良反应】(1) 心血管系统：可见头晕、蹒跚、心悸、发热。(2) 精神神经系统：头痛、头重、失眠、嗜睡。(3) 胃肠道：恶心、呕吐、食欲缺乏、胃部不适、剑突下疼痛、口腔炎。(4) 肝脏：ALT、AST、乳酸脱氢酶升高。(5) 血液系统：贫血、白细胞减少、白细胞增多、嗜酸粒细胞增多。(6) 泌尿系统：尿素氮及肌酐升高，出现蛋白尿。(7) 皮肤：可见湿疹、皮疹及瘙痒等过敏反应及血管神经性水肿。(8) 其他：倦怠、乏力、鼻出血、尿

频、水肿；血钾、总胆固醇、肌酸磷酸激酶及尿酸升高；血清总蛋白减少。

【用法与用量】口服：一次4～8 mg，一日1次，必要时可增加剂量至一次12 mg，一日1次。

【制剂与规格】坎地沙坦酯片：①4mg；②8 mg；③12 mg。

坎地沙坦酯胶囊：①4 mg；②8 mg。

坎地沙坦酯分散片：4 mg。

替米沙坦[保(乙)]

Telmisartan

【适应证】用于原发性高血压。

【注意事项】(1) 妊娠前3个月不推荐使用。(2) 以下情况慎用，如双侧肾动脉狭窄或单侧功能性肾动脉狭窄；血容量不足患者；血管张力以及肾功能主要依赖于肾素-血管紧张素-醛固酮系统活性的患者（如严重充血性心力衰竭或包括肾动脉狭窄的潜在肾脏疾病的患者）；主动脉瓣或二尖瓣狭窄；肥厚型梗阻性心肌病；缺血性心血管疾病；轻中度肝功能不全（一日不应超过40 mg）。(3) 原发性醛固酮增多症的患者不推荐使用。(4) 18岁以下患者。(5) 老年人服用不需要调整剂量。

【禁忌证】对本品过敏者；妊娠中、末期及哺乳；胆汁淤积胆道阻塞性疾病患者；严重肝功能不全患者；严重肾功能不全患者（肌酐清除率＜每分钟30 ml)。

【不良反应】见坎地沙坦。

【用法与用量】口服：应个体化给药，初始剂量，一次40 mg，一日1次。若用药后未达到理想血压可加大剂量，最大剂量为一次80 mg，一日1次。

【制剂与规格】替米沙坦片：①20mg；②40 mg；③80 mg。

替米沙坦胶囊：①20 mg；②40 mg。

奥美沙坦

Olmesartan

【适应证】用于高血压。

【注意事项】(1) 一旦发现妊娠，应当尽快停止使用本药。(2) 目前尚不清楚是否可以经母乳分泌，因为对哺乳新生儿有潜在的不良影响，哺乳期妇女需权衡利弊。(3) 以下情况慎用，如双侧肾动脉狭窄或单侧功能性肾动脉狭窄；血容量不足患者。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者；妊娠中、晚期妇女。

【不良反应】少见头晕，背痛，支气管炎，肌酸激酶升高，腹泻，头痛，血尿，高血糖症、高三酰甘油血症，流感样症状，咽炎，鼻炎和鼻窦炎；偶见咳嗽，胸痛，乏力，疼痛，外周性水肿，眩晕，腹痛，消化不良，肠胃炎，恶心，心动过速，高胆固醇血症，高脂血症，高尿酸血症，关节疼痛，关节炎，肌肉疼痛，骨骼疼痛，皮疹和面部水肿。

【用法与用量】口服：通常起始剂量一次20 mg，一日1次，2周治疗后仍需进一步降低血压的患者，剂量可增至一次40 mg，一日1次。

【制剂与规格】奥美沙坦酯片：①20 mg；②40 mg。

4.10 拟交感血管活性药

拟交感血管活性药是指肾上腺素受体激动药，它们的化学结构与药理作用和肾上腺素、去甲肾上腺素相似，与肾上腺素能受体结合后可激动受体，产生肾上腺素样的作用，又称拟肾上腺素药。因为这类药物大部分是有机胺类，故又称为拟交感胺类。

拟交感血管活性药药物分类及药理作用如下。

(1) α、β受体激动药：包括肾上腺素，多巴胺和麻黄碱。此类药物作用于心肌、传导系统和窦房结的β_1及β_2受体，加强心肌收缩力，加速传导，加快心率，提高心肌兴奋性。激动血管平滑肌上的α受体，血管收缩，而作用于其β_2受体，血管舒张。体内各部位血管的肾上腺素受体的种类和密度不同，导致此类药物对全身不同血管的不同作用。此类药物用量过大时会增加心肌耗氧量，引起心肌缺血和心律失常，血压骤升。肾上腺素主要用于心搏骤停、过敏性疾病与局麻药配伍及局部止血。多巴胺还可作用于外周的多巴胺受体，用于各种休克，也可用于心力衰竭与急性肾衰竭的治疗；其低浓度时可舒张肾

血管，使肾血流量增加，而大剂量时使肾血管收缩导致肾功能下降。

(2) α 受体激动药：包括去甲肾上腺素、间羟胺、去氧肾上腺素和甲氧明。此类药物主要作用于 α 受体，对 β 受体作用较弱；后两者是选择性 α_1 受体激动药。此类药物主要作用于血管的 α_1 受体，使血管收缩，主要收缩小动脉和小静脉，用于休克和低血压的治疗。去甲肾上腺素还可稀释后口服，治疗上消化道出血；去氧肾上腺素还可兴奋瞳孔括约肌，作为短效的散瞳药。此类药物剂量过大或滴注时间过长，可使肾血管剧烈收缩而产生急性肾衰竭，浓度过高可引起局部缺血坏死。

(3) β 受体激动药：包括异丙肾上腺素，多巴酚丁胺及沙丁胺醇。异丙肾上腺素是经典的 β_1 和 β_2 受体激动药，对心脏 β_1 受体具有很强的激动作用，其加快心率、加速传导的作用强大，显著增加心肌耗氧量；同时激动 β_2 受体，使外周血管舒张，支气管平滑肌舒张，因此临床上主要用于房室传导阻滞、心搏骤停及支气管哮喘等的治疗，剂量过大可致心肌耗氧量增加，引起严重的心律失常。多巴酚丁胺是选择性 β 受体激动药，主要激动心脏的 β_1 受体，表现出强大的正性肌力作用，用于心力衰竭与心脏手术后 wqa 心排血量的休克的治疗。要注意由于使心肌耗氧量增加可致急性心肌梗死面积增加，应慎用。肥厚性梗阻型心肌病与房颤患者禁用。

多巴胺[基(基)、保(甲)]

Dopamine

【适应证】用于心肌梗死、创伤、内毒素败血症、心脏手术、肾衰竭、充血性心力衰竭等引起的休克综合征，也可用于洋地黄和利尿药无效的心功能不全。

【注意事项】(1) 对其他拟交感胺类药高度敏感的患者，可能对本品也异常敏感。(2) 妊娠及哺乳期妇女应用时必须权衡利弊。(3) 下列情况慎用，如糖尿病性动脉内膜炎；闭塞性血管病（动脉栓塞、动脉粥样硬化、雷诺病等）；对肢端循环不良；频繁的室性心律失常。(4) 滴注本品时须监测、血压、心排血量、心电图及尿量。(5) 应用多巴胺治疗前必须先纠正低血容量；选用粗大的静脉做静脉注射或静脉滴注，以防药液外溢，及产生组织坏死；如确已发生液体外溢，可用 5～10 mg 酚妥拉明稀释溶液在注射部位做浸润。(6) 静脉滴注时应控制每分钟滴速，滴注的速度和时间，需根据血压、心率、尿量、外周血管灌流情况、异位搏动出现与否等而定。休克纠正时即减慢滴速。(7) 遇有血管过度收缩引起舒张压不成比例升高和脉压减小、尿量减少、心率增快或出现心律失常，滴速必须减慢或暂停滴注。(8) 如在滴注多巴胺时血压继续下降或经调整剂量仍持续低血压，应停用多巴胺，改用更强的血管收缩药。(9) 突然停药可产生严重低血压，故停用时剂量应逐渐递减。

【禁忌证】嗜铬细胞瘤，快速性心律失常，对本品及其他拟交感胺类药高度敏感。

【不良反应】常见胸痛，呼吸困难，心悸，心律失常（尤其用大剂量），乏力；少见头痛，恶心，呕吐。长期应用大剂量或小剂量用于外周血管病患者，可见手足疼痛或发凉；外周血管长时期收缩，可能导致局部坏死或坏疽。

【用法与用量】静脉滴注：在滴注前必须稀释，稀释液的浓度取决于剂量及个体需要的液量，若不需要扩容，可用 0.8 mg/ml 溶液，如有液体潴留，可用 1.6～3.2 mg/ml 溶液。(1)成人常用量，开始时按体重每分钟 1～5μg/kg，10 分钟内以按体重每分钟 1～4μg/kg 速度递增，以达到最大疗效。(2) 慢性顽固性心力衰竭，静脉滴注开始时按体重每分钟 0.5～2μg/kg 逐渐递增。多数按体重每分钟 1～3μg/kg 给予即可生效。(3) 闭塞性血管病变患者，静脉滴注开始时按体重每分钟 1μg/kg，逐渐增至按体重每分钟 5～10μg/kg，直到按体重每分钟 20μg/kg，以达到最满意效应。(4) 危重病例，先按体重每分钟 5 μg/kg 滴注，然后以按体重每分钟 5～10 μg/kg 递增至按体重每分钟 20～50 μg/kg，以达到满意效应；或本品 20 mg 加入 5% 葡萄糖注射液 200～300 ml 中静脉滴注，开始时按每分钟 75～100μg 滴入，以后根据血

压情况，可加快速度和加大浓度，但最大剂量不超过每分钟 500μg。

【制剂与规格】注射用盐酸多巴胺：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

盐酸多巴胺注射液：2 ml : 20 mg。

盐酸多巴胺葡萄糖注射液：250 ml（内含多巴胺 0.2 g、葡萄糖 12.5 g）。

多巴酚丁胺[基（基）, 保（甲）]

Dobutamine

【适应证】用于器质性心脏病时心肌收缩力下降引起的心力衰竭。

【注意事项】(1) 对其他拟交感药过敏，可能对本品也敏感。(2) 妊娠及哺乳期妇女应用时必须权衡利弊。(3) 下列情况慎用，如心房颤动，高血压，严重的机械梗阻（如重度主动脉瓣狭窄），室性心律失常，心肌梗死后。(4) 用药期间应定期或连续监测心电图、血压、心排血量，必要或可能时监测肺毛细血管楔压。(5) 用药前，应先补充血容量、纠正血容量。给药浓度随用量和患者所需液体量而定。(6) 治疗时间和给药速度按患者的治疗效应调整，可依据心率、血压、尿量以及是否出现异位搏动等情况，如果有可能，应监测中心静脉压、肺毛细血管楔压和心排血量。

【禁忌证】对本品或其他拟交感药过敏者。

【不良反应】可见心悸、恶心、头痛、胸痛、气短等。如出现收缩压升高、心率增快，则多与剂量有关，应减量或暂停用药。

【用法与用量】静脉滴注：将多巴酚丁胺加于 5% 葡萄糖液或氯化钠注射液中稀释后使用。一次 250 mg，以每分钟 2.5 ~ 10μg/kg 给予，速度在每分钟 15μg/kg 以下时，心率和外周血管阻力基本无变化；偶用 > 每分钟 15μg/kg，但需注意过大剂量仍然有可能加速心率并产生心律失常。

【制剂与规格】注射用盐酸多巴酚丁胺（按多巴酚丁胺计）：① 0.02 g；② 0.125 g；③ 0.25 g。

盐酸多巴酚丁胺注射液：① 2 ml : 0.02 g；② 20 ml : 0.25 g。

盐酸多巴酚丁胺葡萄糖注射液：① 100 ml（内含多巴酚丁胺 0.05 mg、葡萄糖 5 g）；② 100 ml（内含多巴酚丁胺 0.1 g、葡萄糖 5.0 g）；③ 250 ml（内含多巴酚丁胺 0.125 g、葡萄糖 12.5 g）；④ 250 ml（内含多巴酚丁胺 0.25 g、葡萄糖 12.5 g）；⑤ 250 ml（内含多巴酚丁胺 0.5 g、葡萄糖 12.5 g）。

异丙肾上腺素[基（基）, 保（甲）] 用于心搏骤停，完全房室传导阻滞、心源性休克、感染性休克、支气管哮喘急性发作。用于三度房室传导阻滞、舌下含服（宜将药片嚼碎含于舌下），一次 10 mg，每 4 小时 1 次。静脉滴注：当心率低于每分钟 40 次，以本药 0.5 ~ 1 mg 溶于 5% 葡萄糖注射液 200 ~ 300 ml 中缓慢静脉滴注。用于心搏骤停，心腔内直接注射 0.5 ~ 1 mg。（其他见 2.3.1.2）

肾上腺素[基（基）, 保（甲）]

Adrenaline

【适应证】(1) 用于各种原因引起的心搏骤停进行心肺复苏的主要抢救用药。(2) 用于因支气管痉挛所致严重呼吸困难，可迅速缓解药物等引起的过敏性休克，亦可用于延长浸润麻醉用药的作用时间。

【注意事项】(1) 与其他拟交感药有交叉过敏反应。(2) 下列情况慎用，如器质性脑病、心血管病、青光眼、帕金森病、噻嗪类引起的循环虚脱及低血压、精神神经疾病、孕妇及哺乳期妇女、儿童、老年人。(3) 用量过大或皮下注射误入血管后，可引起血压突然上升导致脑出血。(4) 与局麻药合用一次使用剂量不可超过 300μg，否则可引起心悸、头痛、血压升高等。(5) 抗过敏休克时，须补充血容量。

【禁忌证】高血压、器质性心脏病、冠状动脉疾病、糖尿病、甲状腺功能亢进症、洋地黄中毒、外伤性及出血性休克、心源性哮喘等。

【不良反应】可见心悸、头痛、血压升高、震颤、无力、眩晕、呕吐、四肢发凉、心律失常，严重者心室颤动而致死；用药局部水肿、充血、炎症。

【用法与用量】皮下注射：常用量，一次 0.25 ~ 1 mg；极量，一次 1 mg。(1) 抢救过敏性休克，如青霉素等引起的

过敏性休克。由于本品具有兴奋心脏、升高血压、松弛支气管等作用，故可缓解过敏性休克的心跳微弱、血压下降、呼吸困难等症状。皮下注射或肌内注射 0.5 ~ 1 mg，也可用 0.1 ~ 0.5 mg 缓慢静脉注射（以氯化钠注射液稀释到 10 ml），如疗效不好，可改用 4~8 mg 静脉滴注（溶于 5% 葡萄糖注射液 500 ~ 1 000 ml）。(2) 抢救心搏骤停，可用于麻醉和手术中的意外、药物中毒或心脏传导阻滞等原因引起的心搏骤停，以 0.25 ~ 0.5 mg 以 10 ml 氯化钠注射液稀释后静脉（或心内）注射，同时进行心脏按压、人工呼吸、纠正酸中毒。对电击引起的心搏骤停，亦可用本品配合电除颤仪或利多卡因等进行抢救。(3) 治疗支气管哮喘，效果迅速但不持久。皮下注射 0.25 ~ 0.5 mg，3 ~ 5 分钟见效，但仅能维持 1 小时。必要时每 4 小时可重复注射一次。(4) 与局麻药合用，加少量（1 : 500 000 ~ 1 : 200 000）于局麻药中（如普鲁卡因），在混合药液中，配制成浓度为 2 ~ 5 μg/ml 溶液（1 : 500 000 ~ 1 : 200 000），注射总量不超过 0.3 mg，可减少局麻药的吸收而延长其药效，并减少其不良反应，亦可减少手术部位的出血。(5) 治疗荨麻疹、花粉症、血清反应等，皮下注射 1 : 1 000 溶液 0.2 ~ 0.5ml，必要时再以上述剂量注射一次。(6) 制止鼻黏膜和齿龈出血，将浸有 1 : 20 000 ~ 1 : 1 000 溶液的纱布填塞出血处。

【制剂与规格】盐酸肾上腺素注射液：① 0.5 ml : 0.5 mg；② 1 ml : 1 mg。

米多君[保(乙)]

Midodrine

【适应证】用于下肢静脉充血时血液循环直立性功能失调而造成的低血压症，外科术后、产后失血及气候变化所致的低血压症等；女性压力性尿失禁；男性射精功能障碍。

【注意事项】(1) 治疗时，必须定时监测卧位、坐位和立位血压。(2) 如果出现提示高血压的症状（例如心脏方面的感觉、头痛、视力障碍），必须停止治疗并且向医师咨询。卧位高血压的出现可通过减少剂量来避免。(3) 只应在对初始治疗有反应的患者才继续进行。(4) 对出现严重间歇性血压波动的患者，应当停止治疗。(5) 在治疗时，可出现反射性心动过缓；因此建议对同时使用直接或间接引起心率减慢的药物（例如洋地黄类、β 受体拮抗药、精神类药物等）的患者慎用此药。(6) 如出现心动过缓的症状（例如心率减慢、眩晕加重、意识丧失），必须停止治疗。(7) 对肺源性心脏病患者必须特别谨慎地监测。(8) 青光眼或有眼内压增高危险的患者以及同时使用盐皮质激素类药或氟氢可的松类药的患者，也建议谨慎用药（因为有眼内压增高的可能）。(9) 长期治疗的患者，对血压、心率、电解质及肾功能应进行监测。儿童、老年人和肝功能受损患者应慎用。

【禁忌证】对本品及其中任何成分过敏、严重的心血管疾病、高血压、心律失常、急性肾脏疾病、肾功能不全、前列腺肥大伴残留尿、机械性尿路阻塞、尿潴留、嗜铬细胞瘤、甲状腺功能亢进、青光眼，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见有高血压、胃肠道不适（胃灼热感和恶心）、视物模糊、头痛、眩晕、焦虑、嗜睡、晕厥、感觉异常、瘙痒、口干、尿频、尿急、尿痛、尿潴留及皮疹等。罕见心律失常、寒战，个别患者在剂量较大时可能在头、颈部引起鸡皮疙瘩，或有排尿不尽的感觉。

【用法与用量】(1) 低血压：根据患者自主神经的张力和反应性来进行治疗并作相应的调整。建议用以下剂量：成人和青少年（12 岁以上）：初始剂量一次 2.5 mg，一日 2 次（早、晚服药），必要时可一次 2.5 mg，一日 3 次。根据患者的反应和对此药耐受能力，可将用药剂量增至一次 5 mg，一日 2 ~ 3 次。应当在白天，患者需要起立进行日常活动时服用。建议服药间隔时间为 3 ~ 4 小时。第一剂应当在早晨起床前或后服用，第二剂应当在午间服用，第三剂应当在下午晚些时候服用。为防止卧位高血压，不应在晚餐后或就寝前 4 小时以内服用。(2) 压力性尿失禁：成人一次 2.5 ~ 5 mg，一日 2 ~ 3 次。根据患者情况调整剂量。

【制剂与规格】盐酸米多君片：2.5 mg。

去甲肾上腺素[基(基)，保(甲)]

Noradrenaline

【适应证】用于急性心肌梗死、体外循环引起的低血压，血容量不足所致休克、低血压，嗜铬细胞瘤切除术后的低血压，急救时补充血容量的辅助治疗，椎管内阻滞时的低血压，心搏骤停复苏后血压维持。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如缺氧，高血压，动脉硬化，甲状腺功能亢进症，糖尿病，闭塞性血管炎，血栓病。(2) 用药过程中必须监测动脉压、中心静脉压、尿量、心电图。(3) 儿童应选择粗大静脉，并需更换注射部位。(4) 老人长期大量使用可使心排血量减低。

【禁忌证】可卡因中毒及心动过速患者，高血压病，妊娠期妇女，对其他拟交感胺类药交叉过敏反应者。

【不良反应】药液外漏可引起局部组织坏死；本品强烈的血管收缩可以使重要脏器器官血流减少，特别是对肾血流可锐减；持久或大量使用时后果严重；静脉输注时沿静脉径路皮肤发白、注射局部皮肤破溃、皮肤发绀、发红，严重可眩晕，上述反应虽属少见，但后果严重；过敏反应，有皮疹、面部水肿；过量时，可出现心律失常、血压升高、心率减慢、严重头痛及高血压、焦虑不安、抽搐等。

【用法与用量】本品宜用5%葡萄糖注射液或葡萄糖氯化钠注射液稀释，不宜以氯化钠注射液稀释。静脉滴注：①成人常用量，开始以每分钟8～12μg速度滴注，调整滴速以达到血压升到理想水平；维持量为每分钟2～4μg，必要时可增加，需注意保持或补足血容量。②儿童常用量，开始按体重每分钟0.02～0.1μg/kg速度滴注，按需要调节滴速。

【制剂与规格】重酒石酸去甲肾上腺素注射液：①1 ml：2 mg；②2 ml：10 mg。

去氧肾上腺素[保(乙)]

Phenylephrine

【适应证】用于休克及麻醉时维持血压，室上性心动过速。

【注意事项】(1) 对其他拟交感神经药过敏者，可能对本品也过敏。(2) 动物实验发现有胎儿毒性，妊娠晚期或分娩期间使用，可使子宫的收缩增强，血流量减少，引起胎儿缺氧和心动过缓，故妊娠期妇女在非必要时应避免使用。(3) 下列情况慎用，如老年人，严重动脉粥样硬化，心动过缓，高血压，甲状腺功能亢进症，糖尿病，心肌病，心脏传导阻滞，室性心动过速，周围或肠系膜动脉血栓形成。(4) 老年人慎用，以免引起严重的心动过缓、心排血量降低，应适当减量。(5) 治疗期间除应经常测量血压外，须根据不同情况做其他必要的检查和监测。(6) 药液漏出血管可出现局部缺血性坏死。

【禁忌证】高血压，冠状动脉硬化，甲状腺功能亢进，糖尿病，心肌梗死，近2周内用过单胺氧化酶抑制药。

【不良反应】少见胸部不适，胸痛，眩晕，易激怒，震颤，呼吸困难，虚弱；持续头痛，异常心率缓慢，呕吐，头胀或手足麻刺痛感（提示用药过量）；静脉注射给药治疗阵发性心动过速时常见心率加快或不规则（提示过量）。

【用法与用量】(1) 成人：①局部麻醉，每20 ml可加本品1 mg，达到1：20 000浓度；蛛网膜下腔阻滞时，每2～3 ml加本品2～3 mg达到1：1 000浓度。为预防蛛网膜下腔阻滞期间低血压，可在阻滞前3～4分钟肌内注射本品2～3 mg。②轻或中度低血压，肌内注射一次2～5 mg，再次给药应间隔1～2小时。静脉注射一次0.2 mg，按需要再次给药间隔应为10～15分钟。③阵发性室上性心动过速，初次静脉注射0.5 mg，20～30秒钟注入，以后用量递增，一次增量不超过0.1～0.2 mg，一次极量为1 mg。④严重低血压和休克，以5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液每500 ml中加本品10 mg（1：50 000浓度）静脉滴注，开始时滴速为每分钟0.1～0.18 mg，血压稳定后递减至每分钟0.04～0.06 mg，滴速根据反应调节。(2) 儿童：①预防蛛网膜下腔阻滞期间低血压，肌内注射，按体重40～80μg/kg。②轻到中度低血压，肌内注射，按体重0.1 mg/kg或按体表面积3 mg/m^2，必要时1～2小时后重复1次。

【制剂与规格】注射用盐酸去氧肾上腺素：10 mg。

盐酸去氧肾上腺素注射液：1 ml : 10 mg。

间羟胺[基(基)，保(甲)]

Metaraminol

【适应证】用于防治椎管内阻滞麻醉时发生的急性低血压，由于出血、药物过敏、手术并发症及脑外伤或脑肿瘤合并休克而发生的低血压的辅助对症治疗，心源性休克或败血症所致的低血压。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如甲状腺功能亢进症，高血压，冠心病，充血性心力衰竭，糖尿病，疟疾病史。(2) 血容量不足者应先纠正后再用本品。(3) 本品有蓄积作用，用药后血压上升不明显，须观察 10 分钟后再决定是否增加剂量，以免血压上升过高。(4) 给药时选取较粗大静脉注射，并避免药液外溢。(5) 短期内连续应用，可出现快速耐受性，作用会逐渐减弱。(6) 用药过量可表现为抽搐，严重高血压。(7) 长期使用骤然停药时可能发生低血压。(8) 静脉用药时药液外溢，可引起局部组织坏死，糜烂或红肿硬结形成脓肿。(9) 配制后应于 24 小时内用完，滴注液中不得加入其他难溶于酸性溶液及有配伍禁忌的药物。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】升压反应过快过猛可致急性肺水肿，心律失常，心脏停搏。

【用法与用量】(1) 成人：①肌内或皮下注射，一次 2 ~ 10 mg，在重复用药前对初始量效应至少应观察 10 分钟。②静脉注射，初量 0.5 ~ 5 mg，继而静脉滴注。③静脉滴注，将间羟胺 15 ~ 100 mg 加入 5% 葡萄糖液或氯化钠注射液 500ml 中滴注，调节滴速以维持合适的血压。④成人极量一次 100 mg（每分钟 0.3 ~ 0.4 mg）。(2) 儿童：①肌内或皮下注射：用于严重休克，按体重 0.1 mg/kg。②静脉滴注，按体重 0.4 mg/kg 或按体表面积 12 mg/m^2，用氯化钠注射液稀释至每 25 ml 中含间羟胺 1 mg 的溶液，滴速以维持合适的血压水平为度。

【制剂与规格】重酒石酸间羟胺注射液：① 1 ml : 10 mg；② 5 ml : 50 mg。

4.11 抗血小板药

在动脉粥样硬化斑块破裂基础上血小板黏附、聚集，是动脉粥样硬化血栓形成从而导致心肌梗死、脑卒中等缺血事件的始动因素。抗血小板药（antiplatelet drugs）可抑制血小板聚集，从而抑制动脉中血栓形成，是预防动脉血栓性疾病的重要治疗药物。

抗血小板药按其作用机制可分为四大类：①环氧化酶抑制药，主要为阿司匹林；②腺苷二磷酸受体拮抗药，包括氯吡格雷和噻氯匹定；③磷酸二酯酶抑制药，包括双嘧达莫和西洛他唑；④血小板糖蛋白Ⅱb/Ⅲa 受体拮抗药，包括阿昔单抗（单克隆抗体）、依替巴肽（肽类化合物）和替罗非班（非肽类化合物），目前我国只有替罗非班上市。

阿司匹林是最基本的抗血小板药，对所有发生急性缺血性心血管事件的患者，如心肌梗死、不稳定型心绞痛、缺血性脑卒中、一过性脑缺血发作（TIA）等，若无禁忌，应尽快给予阿司匹林一日 300 mg，1 ~ 7 日之后改为一日 75 ~ 150 mg，长期服用。对所有诊断为冠心病或缺血性脑卒中的患者均应长期服用阿司匹林一日 100 mg（一日 75 ~ 150 mg）作为二级预防。冠状动脉支架置入术前一日起口服阿司匹林一日 300 mg，1 ~ 6 个月（置入裸支架者 1 个月，药物支架 3 ~ 6 个月）后一日 75 ~ 150 mg，长期服用，冠状动脉移植术后长期服用阿司匹林一日 100 mg。对 10 年心血管病风险 > 10% 的人群给予阿司匹林一日 100 mg（一日 75 ~ 100 mg）作为一级预防，可减少心血管事件发生。有高血压的患者给予阿司匹林前应控制血压。

氯吡格雷用于非 ST 段抬高急性冠状动脉综合征，与阿司匹林联合应用，可减少心血管事件，首先给予 300 mg 负荷量，继之一日 75 mg，最好服用 9 ~ 12 个月。ST 段抬高心肌梗死时氯吡格雷一日 75 mg 与阿司匹林联用 4 周。冠状动脉支架置入术前给予氯吡格雷负荷量 300 mg，

继之一日 75 mg，置入裸金属支架者至少服用 4 周，置入药物洗脱支架者至少服用 1 年（应与阿司匹林联用）。对阿司匹林过敏或不耐受的患者，氯吡格雷可作为阿司匹林的替代治疗，用于与心血管病的一级和二级预防。（其他见 4.11.1）

双嘧达莫可与小剂量阿司匹林联合应用，主要用于脑卒中的二级预防。（其他见 4.11.3）

西洛他唑主要用于外周血管病的治疗。近年来也有研究用于冠状动脉支架置入术后，与阿司匹林、氯吡格雷联用，用于支架内血栓高危患者。（其他见 4.11.3）

血小板糖蛋白Ⅱb/Ⅲa 受体拮抗药主要用于急性冠状动脉综合征或高危病变的介入治疗，减少缺血并发症，替罗非班也可用于非 ST 段抬高急性冠状动脉综合征高危患者不进行介入治疗者。

4.11.1 血小板环氧化酶抑制药

阿司匹林[基(基)，保(甲)]

Aspirin

【适应证】抑制下列情况下的血小板黏附和聚集：不稳定型心绞痛，急性心肌梗死，动脉血管术后，预防大脑一过性血流减少。也用于解热镇痛（常用于感冒、流感及各种原因的发热、头痛、牙痛、月经痛、神经痛、肌肉痛、术后钝痛等）抗炎、抗风湿（急性风湿热、风湿性关节炎和类风湿关节炎）。

【注意事项】(1) 交叉过敏，对本药过敏也可能对其他非甾体抗炎药过敏。(2) 严重的肝功能障碍慎用，肝功能减退时可加重肝毒性反应，加重出血倾向，肝功能不全和肝硬化患者易出现肾脏不良反应。(3) 肾损害时慎用，肾衰竭时可有加重肾毒性的危险。(4) 本品易于通过胎盘屏障。动物实验在妊娠头 3 个月应用本品可致畸胎，在妊娠后 3 个月长期大量应用本品可使妊娠期延长，有增加过期产综合征及产前出血的危险。在妊娠的最后 2 周应用，可增加胎儿出血或新生儿出血的危险，在妊娠晚期长期用药也有可能使胎儿动脉导管收缩或早期闭锁，导致新生儿持续性肺动脉高压及心力衰竭。(5) 本品可在乳汁中排泄，长期大剂量用药时婴儿有可能产生不良反应。(6) 下列情况慎用，如对其他镇痛药、抗炎药或抗风湿药过敏；花粉性鼻炎、鼻息肉或慢性呼吸道感染（特别是过敏性症状）者；同时使用抗凝药物（低剂量肝素治疗除外）；支气管哮喘；慢性或复发性胃或十二指肠病变；肾损害；严重的肝功能障碍；葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺陷者（偶见引起溶血性贫血）；痛风（可影响排尿酸药的作用，小剂量时可能引起尿酸滞留）。(7) 儿童或青少年服用可能发生少见但致命的 Reye 综合征。(8) 老年患者肾功能下降时容易出现不良反应。

【禁忌证】对本品或含水杨酸的物质过敏，胃、十二指肠溃疡，出血倾向（出血体质）。

【不良反应】(1) 消化系统：恶心、呕吐、上腹部不适、疼痛、溃疡、胃肠出血、ALT 及 AST 升高。(2) 血液系统：凝血酶原减少、凝血时间延长、贫血、粒细胞减少、血小板减少、出血倾向。(3) 中枢神经系统：头晕、头痛、耳鸣、听力下降、精神障碍等。(4) 呼吸系统：呼吸困难（阿司匹林哮喘）、鼻息肉、肺水肿。(5) 内分泌系统：血尿酸增高。(6) 皮肤：过敏、味觉异常、脱发、皮疹。(7) 其他：水杨酸中毒。

【用法与用量】口服：(1) 心脑血管疾病一级预防，一次 75 ~ 100 mg，一日 1 次。(2) 心脑血管疾病二级预防，一次 75 ~ 150 mg，一日 1 次。(3) 急性心肌梗死、冠状动脉内药物洗脱支架置入术后，1 个月内，建议一次 300 mg，一日 1 次。以上肠溶片不可掰开或嚼服。(4) 急性冠状动脉综合征急诊 PCI 术前，顿服 300 mg，应使用非肠溶片或嚼服肠溶片。(5) 解热、镇痛，一次 0.3 ~ 0.6 g，一日 3 次，必要时 4 小时 1 次。(6) 抗炎、抗风湿，一日 3 ~ 6 g，分 4 次服用。

【制剂与规格】阿司匹林肠溶片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

阿司匹林肠溶胶囊：① 75 mg；② 100 mg；③ 150 mg。

阿司匹林精氨酸盐粉针：① 0.5 g（相当于阿司匹林 0.25 g）；② 1 g（相当于阿

司匹林 0.5 g)。(用于解热镇痛)

阿司匹林赖氨酸盐粉针:① 0.25 g (相当于阿司匹林 0.14 g);② 0.5 g (相当于阿司匹林 0.28 g);③ 0.9 g (相当于阿司匹林 0.5g)。(用于解热镇痛)

4.11.2 腺苷二磷酸受体拮抗药

氯吡格雷[保(乙)]

Clopidegrel

【适应证】用于心肌梗死(从几日到< 35 日),缺血性脑卒中(从 7 日到< 6 个月),确诊的外周动脉性疾病,急性冠状动脉综合征。

【注意事项】(1) 肾功能不全时不需要调整剂量,但经验有限,需慎用。(2) 妊娠期间避免使用。(3) 下列情况慎用,如创伤、外科手术或其他病理状态使出血危险性增加者,接受阿司匹林、非甾体抗炎药、肝素、血小板糖蛋白 Ⅱb/Ⅲa 抑制药或溶栓药物治疗者,出血性疾病(尤其是胃肠及眼内疾病)者。(4) 用药期间监测异常的出血情况、白细胞和血小板计数。择期手术且无须抗血小板治疗者,术前 1 周停用本药。(5) 合用质子泵抑制药可能影响疗效。

【禁忌证】对本品过敏,严重肝功损害患者,活动性病理性出血(如活动性消化性溃疡或颅内出血),哺乳期妇女。

【不良反应】偶见胃肠道反应(腹痛、消化不良、便秘或腹泻),皮疹,皮肤黏膜出血;罕见白细胞减少和粒细胞缺乏。

【用法与用量】口服:一次 75 mg,一日 1 次。(1) 非 ST 段抬高性急性冠状动脉综合征(不稳定型心绞痛或非 Q 波心肌梗死),单次负荷量 300 mg 开始,然后一日 1 次 75 mg 连续服药(联合阿司匹林一日 75 ~ 325 mg),推荐阿司匹林不超过 100 mg。最佳疗程尚未确定。(2) ST 段抬高性急性心肌梗死,以负荷量氯吡格雷开始,然后一日 1 次 75 mg 连续服药,合用阿司匹林,可合用或不合用溶栓剂。年龄超过 75 岁时,不使用负荷剂量。症状出现后尽早开始联合治疗,至少用药 4 周。(3) 冠状动脉内药物支架置入后,应持续服用一日 1 次,每次 75 mg,不少于 1 年,并应与阿司匹林一日 100 mg 联合应用。

【制剂与规格】硫酸氯吡格雷片:① 25 mg;② 75 mg。

噻氯匹定[保(乙)]

Ticlopidine

【适应证】用于预防和治疗因血小板高聚集状态引起的心、脑及其他动脉的循环障碍疾患。

【注意事项】(1) 严重的肝功能损害患者,由于凝血因子合成障碍、往往增加出血的危险,不宜使用。(2) 严重的肾功能损害患者,由于肾清除率降低,导致血药浓度升高,从而加重肾功能损害。故使用本品时应密切监测肾功能,必要时可减量。(3) 本品可透过胎盘屏障,应避免用于妊娠期妇女。(4) 本品可进入母乳,应避免用于哺乳期妇女。(5) 用药期间应定期监测血象,最初 3 个月内每 2 周 1 次,一旦出现白细胞或血小板下降即应停药,并继续监测至恢复正常。(6) 服用本品时候若患者受伤且导致继发性出血的危险时,应暂停服本药。(7) 择期手术(包括拔牙)前 10 ~ 24 日应停用本品。(8) 用药过程中若发生出血并发症,输血小板可帮助止血。

【禁忌证】对本品过敏,血友病或其他出血性疾病,凝血障碍或活动性病理性出血,有血小板减少、白细胞减少或粒细胞减少病史,再生障碍性贫血时。

【不良反应】可见白细胞减少,粒细胞缺乏,血栓性血小板减少性紫癜,再生障碍性贫血。严重的粒细胞缺乏及血小板减少有致命的危险。胆汁阻塞性黄疸,肝功能损害。偶见轻度的胃肠道反应。罕见恶心,腹泻,皮疹,瘀斑,齿龈出血。

【用法与用量】口服:一次 0.25 g,一日 1 次。本品宜于进餐时服药,因食物可提高其生物利用度并减低胃肠道的不良反应。

【制剂与规格】盐酸噻氯匹定片:① 0.125 g;② 0.25 g。

盐酸噻氯匹定胶囊:① 0.125 g;② 0.25 g。

4.11.3 磷酸二酯酶抑制药

双嘧达莫[基(基),保(甲/乙)]

Dipyridamole

【适应证】用于缺血性心脏病，血栓栓塞性疾病，诊断心肌缺血的药物实验（注射剂）。

【注意事项】(1) 未在孕妇中做适当的对照研究，仅当确有必要方可用于孕妇。(2) 下列情况慎用，如低血压、有出血倾向者、哺乳期妇女。(3) 严重冠脉病变患者使用后缺血可能加重（窃血现象）。(4) 与肝素合用可能引起出血倾向。(5) 不宜与葡萄糖以外的其他药物混合注射。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】胃肠道反应，头痛，眩晕，疲劳，皮疹，潮红。

【用法与用量】(1) 口服：一次 25 ~ 50 mg，一日 3 次，餐前 1 小时服用。缓释胶囊一次 200 mg，一日 2 次。(2) 注射：诊断心肌缺血的药物试验，用 5% 或 10% 葡萄糖注射液稀释后静脉滴注。给药速度为按体重每分钟 0.142 mg/kg，静脉滴注共 4 分钟。

【制剂与规格】双嘧达莫片：25 mg。

双嘧达莫注射液：2 ml : 10 mg。

注射用双嘧达莫：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

西洛他唑[保(乙)]

Cilostazol

【适应证】用于由动脉粥样硬化、大动脉炎、血栓闭塞性脉管炎、糖尿病所致的慢性动脉闭塞症；改善肢体缺血所引起的慢性溃疡、疼痛、发冷及间歇跛行及上述疾病的外科治疗后的补充治疗，协助缓解症状、改善循环及抑制移植血管内血栓形成。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如已服用口服抗凝药及抗血小板药，严重肝肾功能不全，严重并发症，白细胞减少，过敏体质。(2) 本品有升高血压的作用，服药期间应加强原有抗高血压的治疗。

【禁忌证】出血性疾病患者，妊娠和哺乳期妇女。

【不良反应】常见头痛，头晕，心悸等，个别血压偏高；腹胀，恶心，呕吐，胃不适，腹痛等；少见肝功能异常，尿频，尿素氮、肌酐及尿酸值异常；过敏（皮疹、瘙痒）；偶见白细胞减少，皮下出血，消化道出血，鼻出血，血尿，眼底出血等。

【用法与用量】口服：成人，一次 50 ~ 100 mg，一日 2 次，年轻患者可根据症状必要时适当增加剂量。

【制剂与规格】西洛他唑片：① 50 mg；② 100 mg。

奥扎格雷[保(乙)]

Ozagrel

【适应证】用于治疗急性血栓性脑梗死和脑梗死所伴随的运动障碍。

【注意事项】(1) 避免与含钙注射液混合使用。(2) 妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】出血性脑梗死或大面积脑梗死深昏迷，严重心、肺、肝、肾功能不全，血液病或出血倾向，严重高血压（收缩压≥ 200 mmHg），对本品过敏。

【不良反应】常见胃肠道反应，过敏反应。少见 GPT、BUN 升高，血小板减少。

【用法与用量】成人常用量一次 40 ~ 80 mg，一日 1 ~ 2 次，溶于 500 ml 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖溶液中，连续静脉滴注，1 ~ 2 周为 1 个疗程。另外根据年龄、症状适当增减用量。

【制剂与规格】奥扎格雷钠注射液：2 ml : 40 mg。

奥扎格雷钠氯化钠注射液：250 ml，内含奥扎格雷钠 80 mg、氯化钠 2.25 g。

奥扎格雷钠葡萄糖注射液：250 ml，内含奥扎格雷钠 80 mg、葡萄糖 12.5 g。

4.11.4 血小板膜糖蛋白Ⅱb/Ⅲa 受体拮抗药

替罗非班[保(乙)]

Tirofiban

【适应证】用于不稳定型心绞痛或非 ST 段抬高心肌梗死，急性冠状动脉综合征患者进行冠脉血管成形术或冠脉内斑块切除术。

【注意事项】(1) 轻中度肝功能不全

者不需调整剂量。(2) 血浆清除率<每分钟 30 ml（包括需要血液透析）的患者，剂量应减少 50%。(3) 妊娠安全性不确定，孕妇使用权衡利弊。哺乳期妇女权衡利弊决定中断哺乳还是中断药物治疗。(4) 以下情况慎用，如 1 年内出血；已知的凝血障碍、血小板异常或血小板减少病史；1 年内的脑血管病史；1 个月内的外科手术或严重躯体创伤史；未控制的高血压 [收缩压> 180 mmHg 和（或）舒张压> 110 mmHg]；急性心包炎；出血性视网膜病；慢性血液透析。(5) 仅供静脉使用。本品可与肝素联用，从同一液路输入。必须注意避免长时间负荷输入。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者；有活动性内出血、颅内出血史、颅内肿瘤、动静脉畸形及动脉瘤；主动脉夹层；既往使用替罗非班出现血小板减少的患者。

【不良反应】出血，如颅内出血、腹膜后出血、心包积血、肺出血和脊柱硬膜外血肿、致死性出血；急性及（或）严重血小板计数减少可伴有寒战、轻度发热或出血并发症；过敏反应，恶心，发热，头痛，血红蛋白、血细胞比容下降。

【用法与用量】根据患者体重计算静脉注射剂量和滴注速率。(1) 不稳定型心绞痛或非 ST 段抬高心肌梗死：与肝素联用由静脉输注，起始 30 分钟滴注速率为每分钟 0.4μg/kg，然后以每分钟 0.1μg/kg 的速率维持滴注。与肝素联用滴注一般至少持续 48 小时，并可达 108 小时。(2) 冠状动脉介入治疗：与肝素联用由静脉输注，起始注射剂量为 10μg/kg，在 3 分钟内注射完毕，而后以每分钟 0.15μg/kg 的速率维持滴注。本品维持量滴注应持续 36 小时。以后停用肝素。如果患者激活凝血时间< 180 秒应撤掉动脉鞘管。

【制剂与规格】盐酸替罗非班氯化钠注射液：100 ml，内含盐酸替罗非班 5 mg、氯化钠 0.9 g。

注射用盐酸替罗非班：5 mg。

利伐沙班 [保(乙)]

Rivaroxaban

【适应证】用于择期髋关节或膝关节置换手术成年患者，以预防静脉血栓形成 (VTE)。

【注意事项】(1) 一些亚群的患者的出血风险较高。治疗开始后，要对这些患者实施密切监测，观察是否有出血并发症征象。(2) 在重度肾损害（肌酐清除率<每分钟 30 ml）患者中，本品的血药浓度可能显著升高，不建议用于肌酐清除率<每分钟 15 ml 的患者。肌酐清除率为每分钟 15 ~ 29 ml 的患者应慎用。(3) 伴有出血风险的患者应慎用。(4) 有罕见的遗传性半乳糖不耐受、Lapp 乳糖酶缺乏或葡萄糖-半乳糖吸收不良问题的患者不能服用该药。(5) 18 岁以下的青少年或儿童不推荐使用。(6) 可能影响驾车和使用机械能力。

【禁忌证】对本品或其中任何成分过敏者；有临床明显活动性出血的患者；具有凝血异常和临床相关出血风险的肝病患者；妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】常见术后出血、贫血、恶心、ALT、AST 升高。少见晕厥、头晕、头痛、心动过速、胃功能损害。罕见过敏性皮炎、瘙痒、荨麻疹等。

【用法与用量】口服：推荐剂量为一次 10 mg，一日 1 次。如伤口已止血，应于手术后 6 ~ 10 小时首次用药。治疗疗程长短依据每个患者发生静脉血栓栓塞事件的风险而定，即由患者所接受的骨科手术类型而定。对于接受髋关节大手术的患者，推荐 1 个疗程服药 5 周。对于接受膝关节大手术的患者，推荐 1 个疗程服药 2 周。如果发生漏服 1 次，患者应立即补服，并于次日继续一天服药 1 次。患者可以在进餐时服用，也可以单独服用。

【制剂与规格】利伐沙班片：10 mg。

4.11.5 其他抗血小板药

贝前列素 [保(乙)]

Beraprost

【适应证】改善慢性动脉闭塞性疾病引起的溃疡、间歇性跛行、疼痛和冷感等症状。

【注意事项】下列患者慎用：正在使用抗凝血药、抗血小板药、血栓溶解剂的患者；月经期的妇女；有出血倾向及其因

素的患者。

【禁忌证】妊娠妇女和出血性疾病患者禁用。

【不良反应】可有出血倾向（包括脑出血、消化道出血、眼底出血等）、颜面潮红、头痛等。

【用法与用量】口服：成人一日120 μg，分3次于餐后服用。

【制剂与规格】贝前列素钠片：20 μg。

沙格雷酯[保（乙）]

Sarpogrelate

【适应证】用于改善慢性动脉闭塞症引起的溃疡、疼痛等缺血性症状。

【注意事项】(1) 慎用：①既往使用同类药物（如盐酸噻氯匹定）引起粒细胞缺乏、血小板减少者；②月经期妇女；③有出血倾向者；④正在服用抗凝药或抑制血小板聚集药的患者；⑤肾功能严重受损者。(2) 哺乳期妇女不宜使用本品。(3) 用药前后及用药时应当检查或监测血常规及血小板计数。

【禁忌证】(1) 出血患者。(2) 妊娠及可能已妊娠的妇女。

【不良反应】少数患者可出现皮疹、面部潮红、气短、胸部压抑感、头痛、恶心、异味感、异物感、胃灼热、胃痛、便秘、水肿、体重增加等。严重不良反应有脑出血、消化道出血、血小板减少、肝功能障碍、黄疸，ALT、AST等升高。

【用法与用量】常用量：成人一次100 mg，一日3次，饭后口服。但应根据年龄、症状的不同适当增减药量。

【制剂与规格】盐酸沙格雷酯片：100 mg。

4.12 纤维蛋白溶解药及抗凝药

4.12.1 急性心肌梗死及其药物治疗

急性心肌梗死（acute myocardial infarction，AMI）是指因冠状动脉供血急剧减少或中断（大多是由于冠脉内血栓形成），使相应心肌持久而严重的缺血导致心肌坏死，是冠心病临床类型中最为严重的疾病。临床上依据典型的缺血性胸痛（胸骨后剧烈疼痛）、心肌坏死标志物（肌酸激酶、肌钙蛋白）增高、特异性的心肌缺血损害心电图改变（病理性Q波、ST段弓背样抬高或缺血性ST段下降、T波倒置）可及时做出诊断。根据心电图ST段表现，可将AMI分为急性ST段抬高心肌梗死（STEMI）和非ST段抬高心肌梗死（NSTEMI）。

4.12.1.1 STEMI治疗原则

一旦诊断明确，必须立即开始治疗。

(1) 一般处理：包括卧床休息、开放静脉通道、吸氧、心电及血压监测、镇静止痛（一般选用吗啡静脉注射）。如无禁忌证，通常使用硝酸甘油静脉滴注24～48小时和阿司匹林300 mg及氯吡格雷300 mg即刻口服。

(2) 再灌注治疗：尽早使急性闭塞的冠脉再通，挽救濒死的缺血心肌，是降低AMI死亡率和改善远期预后的关键。目前采用的主要手段为溶栓治疗和介入治疗（PCI）。

①溶栓治疗：适应证为对无进行冠状动脉介入治疗术（PCI）条件的医疗单位，在确诊的急性ST段抬高心肌梗死，起病时间＜12小时，年龄＜75岁；如起病时间12～24小时，患者仍有缺血性胸痛和广泛导联ST段抬高，经过选择仍可考虑溶栓治疗。禁忌证包括既往有出血性脑卒中史、一年内发生过缺血性脑卒中和脑血管事件；颅内肿瘤；近期（2～4周）有活动性出血、创伤、不能压迫部位的大血管穿刺、外科大手术和时间＞10分钟以上的心肺复苏；严重高血压病史（≥180/110 mmHg）；妊娠；活动性消化性溃疡；既往曾使用链激酶（尤其是5日至2年内）或对其过敏者。常用药物包括尿激酶，建议用量为150万U于30分钟内静脉滴注，配合肝素皮下注射7 500～10 000 U，每12小时1次，或低分子肝素皮下注射，一日2次；链激酶，建议用量为150万U于1小时内静脉滴注，配合肝素皮下注射7 500～10 000 U，每12小时1次，或低分子肝素皮下注射，一日2次；重组组织型纤溶酶原激活物，国外推荐静脉给药总量为100 mg，但国内

TUCC 试验建议用量 50 mg，具体见药物用法与用量。

②介入治疗：对 AMI 患者进行直接 PCI，其梗死血管再通率及患者预后明显优于溶栓治疗。在进行 PCI 前，患者应常规口服阿司匹林 300 mg 及氯吡格雷 300 mg，PCI 后给予维持量治疗。阿司匹林一日 100 mg，建议终身服用；如单纯 PTCA 或置入裸金属支架，氯吡格雷建议一日 75 mg，服用 1 ~ 3 个月；如置入药物洗脱支架，建议氯吡格雷服用不少于 12 个月。

(3) 药物治疗：AMI 的药物治疗包括如下几类。

①扩血管药物：常用静脉滴注硝酸甘油，一般作为早期应用（48 小时以内）。口服硝酸异山梨醇酯或单硝酸异山梨醇酯。②抗血小板药。常用阿司匹林或氯吡格雷。抗血小板药是患者长期服用的药物之一。③血管紧张素转换酶抑制药(ACEI)或血管紧张素 II 受体拮抗药（ARB）。AMI 早期应用 ACEI 或 ARB 类药物对防止心脏重构、改善心功能有重要作用，只要无禁忌证者都应尽早使用。④ β 受体拮抗药。对缩小心肌梗死面积、降低急性期死亡率、提高远期疗效有重要作用，在无药物应用禁忌证的情况下应及早常规应用。⑤钙通道阻滞药。非 AMI 的一线治疗药物。⑥抗凝药。可作为溶栓治疗或 PCI 的辅助治疗，抗凝药物对抑制和预防血栓形成有很大作用。常规使用肝素或低分子肝素。

(4) 并发症治疗：AMI 常见的并发症为心力衰竭、心源性休克、心律失常、机械性并发症（室间隔穿孔、心室游离壁破裂、乳头肌断裂）等均可按相关疾病常规处理。

(5) 其他治疗：对患者所有的危险因素要进行干预，强调控制血压、应用他汀类药物控制血脂、控制血糖等。

4.12.1.2 NSTEMI 治疗原则

对确诊 NSTEMI 患者要随时根据病情变化进行危险分层，调整治疗措施。原则上，NSTEMI 禁止采用溶栓治疗。其他治疗方案与 STEMI 基本相同。但要特别强调早期应用足量的抗血小板治疗及抗凝治疗。在采用急诊 PCI 治疗的患者，可应用血小板糖蛋白 II b/ III a 受体阻滞药。

4.12.2 纤维蛋白溶解药

尿激酶 [保(甲)]

Urokinase

【适应证】用于血栓栓塞性疾病的溶栓治疗（包括急性广泛性肺栓塞、胸痛 6 ~ 12 小时的冠状动脉栓塞和心肌梗死、症状短于 3 ~ 6 小时的急性期脑血管栓塞、视网膜动脉栓塞和其他外周动脉栓塞症状严重的髂 - 股静脉血栓形成者）；人工心瓣手术后预防血栓形成；保持血管插管和胸腔及心包腔引流管的通畅。

【注意事项】(1) 下列情况应权衡利弊后慎用，如近 10 日内分娩、进行过组织活检、静脉穿刺、大手术的患者及严重胃肠道出血患者；极有可能出现左心血栓者（如二尖瓣狭窄伴心房颤动）；亚急性感染性心内膜炎患者；继发于肝肾疾病而有出血倾向或凝血障碍者；妊娠及哺乳期妇女；脑血管病患者；糖尿病性出血性视网膜病者。(2) 溶栓的疗效均需后继的肝素抗凝加以维持。(3) 应用本品前，应对患者进行血细胞比容、血小板计数、凝血酶时间（TT）、凝血酶原时间（PT）、激活的部分凝血活酶时间（APTT）及优球蛋白溶解时间（ELT）的测定。TT 和 APTT 应小于 2 倍延长的范围内。(4) 用药期间应密切观察患者反应，如脉率、体温、呼吸频率和血压、出血倾向等，至少 4 小时记录 1 次。(5) 静脉给药时，要求穿刺一次成功，以避免局部出血或血肿。(6) 动脉穿刺给药时，给药结束应在穿刺局部加压至少 30 分钟，并用无菌绷带和敷料加压包扎，以免出血。

【禁忌证】急性内脏出血，急性颅内出血，陈旧性脑梗死，近 2 个月内进行过颅内或脊髓内外科手术，颅内肿瘤，动静脉畸形或动脉瘤，血液凝固异常、严重难控制的高血压患者，主动脉夹层，感染性心内膜炎。相对禁忌证包括延长的心肺复苏术，严重高血压，近 4 周内的外伤，3 周内手术或组织穿刺，分娩后 10 日，活

动性溃疡病，重症肝脏疾病。

【不良反应】常见出血；其他有头痛，恶心，呕吐，食欲缺乏；少见有发热，过敏等。

【用法与用量】本品临用前应以氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液配制。(1) 肺栓塞：初次剂量按体重4 400 U/kg，以氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液配制，以每小时90 ml速度10分钟内滴完；其后以每小时4 400 U的给药速度，连续静脉滴注2小时或12小时。也可按体重15 000 U/kg，氯化钠注射液配制后肺动脉内注入；必要时，可根据情况调整剂量，间隔24小时重复一次，最多使用3次。(2) 心肌梗死：建议以氯化钠注射液配制后，按每分钟6 000 U冠状动脉内连续滴注2小时，滴注前应先行静脉给予肝素2 500～10 000 U。也可将本品150万U配制后静脉滴注，30分钟滴完。(3) 外周动脉血栓：以氯化钠注射液配制本品(浓度2 500 U/ml)，每分钟4 000 U速度经导管注入血凝块。每2小时夹闭导管1次；可调整滴入速度为每分钟1 000 U，直至血块溶解。(4) 防治心脏瓣膜替换术后的血栓形成：可用本品4 400 U/kg，0.9%氯化钠注射液配制后10分钟到15分钟滴完。然后以每小时4 400 U/kg静脉滴注维持。当瓣膜功能正常后即停止用药；如用药24小时仍无效或发生严重出血倾向应停药。(5) 脓胸或心包积脓：常用抗生素和脓液引流术治疗。引流管常因纤维蛋白形成凝块而阻塞引流管。此时可胸腔或心包腔内注入灭菌注射用水配制(5 000 U/ml)的本品10 000～250 000 U。既可保持引流管通畅，又可防止胸膜或心包粘连或形成心包缩窄。(6) 眼科应用：用于溶解眼内出血引起的前房血凝块。使血块崩解，有利于手术取出。常用量为5 000 U用2 ml氯化钠注射液配制冲洗前房。

【制剂与规格】注射用尿激酶：①500 U；②5 000 U；③1万U；④2万U；⑤5万U；⑥10万U；⑦20万U；⑧25万U；⑨50万U；⑩150万U；⑪250万U。

纤溶酶[保(乙)]

Fibrinogenase

【适应证】用于脑梗死、高凝血状态及血栓性脉管炎等外周血管疾病。

【注意事项】(1) 用药过程中如出现患肢胀麻、酸痛、头胀痛、发热感、出汗、多眠等，可自行消失或缓解，不需特殊处理。(2) 用药过程中如出现血尿或皮下出血点，应立即停止使用，并对症处理。(3) 血小板＜80×10^9/L应停药观察。严重高血压应控制在180/110 mmHg以下才能应用，若舒张压偏高应使用5%葡萄糖溶液作稀释液，而不用0.9%氯化钠注射液。糖尿病患者则应用0.9%氯化钠注射液作稀释液，而不用5%葡萄糖溶液。(4) 两个疗程之间应间隔5～7日。(5) 使用时应检查药液有无浑浊、沉淀现象，若有上述现象不得使用。(6) 儿童患者应慎用。(7) 老年患者是本品应用的主要对象之一，但安全性尚未见确切报道，临床使用中必须严密观察。(8) 过敏体质者慎用。

【禁忌证】(1) 有凝血机制障碍、出血倾向患者禁用。(2) 严重肝肾功能损伤、活动性肺结核空洞及消化性溃疡患者禁用。(3) 孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 可发生创面、注射部位、皮肤及黏膜出血。(2) 可引起头痛、头晕或ALT及AST升高。极少量病人可致过敏反应。

【用法与用量】静脉滴注。(1) 预防用：治疗高凝血状态时，一次100 U，以注射用水适量溶解后，加到250 ml氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液中，以每分钟45～50滴的速度进行静脉滴注，一日1次。14日为1个疗程。(2) 治疗用：若患者一般状况较好，除第一次使用100 U外，以后可一日使用1次，一次用200～300 U，加到500 ml 0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液中稀释进行静脉滴注，7～10日为1个疗程。若患者一般状况较差，除第一次使用100 U外，以后可隔日用200 U进行静脉滴注，一个疗程仍为7～10日。

【制剂与规格】注射用纤溶酶：1 ml：100 U。

链激酶[保(甲)]

Streptokinase

【适应证】用于急性心肌梗死等血栓性疾病。

【注意事项】用本品治疗血管再通后，发生再梗死，可用其他溶栓药。

【禁忌证】对本品过敏者；2 周内有出血、手术、外伤史、心肺复苏或不能实施压迫止血的血管穿刺等者；近 2 周内有溃疡出血病史、食管静脉曲张、溃疡性结肠炎或出血性视网膜病变者；未控制的高血压（血压＞180/110 mmHg），不能排除主动脉夹层者；凝血障碍及出血性疾病患者；严重肝肾功能障碍患者；二尖瓣狭窄合并心房颤动伴左房血栓者；感染性心内膜炎患者；链球菌感染者；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见发热，寒战，恶心，呕吐，肩背痛，过敏性皮疹；低血压（静脉滴注）；罕见过敏性休克；出血（穿刺部位出血，皮肤瘀斑，胃肠道、泌尿道或呼吸道出血）；脑出血；再灌注心律失常，偶见缓慢心律失常、加速性室性自搏性心律、室性期前收缩或心室颤动等；偶见溶血性贫血，黄疸及 ALT 升高；溶栓后继发性栓塞（肺栓塞，脑栓塞或胆固醇栓塞等）。

【用法与用量】急性心肌梗死静脉溶栓治疗：150 万 U 溶解于 5% 葡萄糖液 100 ml，静脉滴注 1 小时。应尽早开始，争取发病 12 小时内开始治疗。对于特殊患者（如体重过低或明显超重），可根据具体情况适当增减剂量（按 2 万 U/kg 体重计）。

【制剂与规格】注射用重组链激酶：① 10 万 U；② 50 万 U；③ 150 万 U。

阿替普酶[保(乙)]

Alteplase

【适应证】用于急性心肌梗死的溶栓治疗，血流不稳定的急性大面积肺栓塞的溶栓治疗，急性缺血性脑卒中的溶栓治疗。

【注意事项】见尿激酶。本品不适用于 18 岁以下及 80 岁以上的急性脑卒中患者。本药不宜与其他药物做配伍静脉滴注。

【禁忌证】出血体质；口服抗凝血药；目前或近期有严重的或危险的出血；已知有颅内出血史或疑有颅内出血；疑有蛛网膜下腔出血或处于因动脉瘤而导致蛛网膜下腔出血状态；有中枢神经系统病变史或创伤史（如肿瘤、动脉瘤以及颅内或椎管内手术）；最近（10 日内）曾进行有创的心外按压、分娩或非压力性血管穿刺（如锁骨下或颈静脉穿刺）；严重的未得到控制的动脉高血压；主动脉夹层；感染性心内膜炎或心包炎；急性胰腺炎；最近 3 个月有胃肠溃疡史、食管静脉曲张、动脉瘤或动脉／静脉畸形史；出血倾向的肿瘤；严重的肝病，包括肝衰竭、肝硬化、门静脉高压（食管静脉曲张）及活动性肝炎；最近 3 个月内有严重的创伤或大手术。治疗急性心肌梗死、急性肺栓塞时的补充禁忌证，有脑卒中史。治疗急性缺血性脑卒中时的补充禁忌证，缺血性脑卒中症状发作已超过 3 小时尚未开始静脉滴注治疗或无法确知症状发作时间；开始静脉滴注治疗前神经学指征不足或症状迅速改善；经临床（NIHSS＞25）和（或）影像学检查评定为严重脑卒中；脑卒中发作时伴随癫痫发作；CT 扫描显示有颅内出血迹象；尽管 CT 扫描未显示异常，仍怀疑蛛网膜下腔出血；48 小时内曾使用肝素且凝血酶原时间高于实验室正常值上限；有脑卒中史并伴有糖尿病；近 3 个月内有脑卒中发作；血小板计数低于 100×10^9/L；收缩压＞185 mmHg 或舒张压＞110 mmHg，或需要强力（静脉内用药）治疗手段以控制血压；血糖低于 2.8 mmol/L 或高于 22.2 mmol/L。

【不良反应】见尿激酶。

【用法与用量】静脉注射：使用注射用水配制浓度为 1 mg/ml 或 2 mg/ml，配制溶液可用氯化钠注射液稀释至 0.2 mg/ml 的最小浓度。(1) 急性心肌梗死：①对于发病后 6 小时内给予治疗的患者，采取 90 分钟加速给药法：15 mg 静脉注射，其后 30 分钟内静脉滴注 50 mg，其后 60 分钟给予 35 mg 静脉滴注，直至最大剂量达 100 mg。体重低于 65 kg 者，给予 15 mg 静

脉注射，以后30分钟内按0.75 mg/kg静脉滴注，而后60分钟按0.5 mg/kg。②发病后6～12小时给予治疗的患者，采取3小时给药法。10 mg静脉注射，其后1小时持续静脉滴注50 mg，剩余剂量每30分钟静脉滴注10 mg，至3小时滴完，最大剂量100 mg。体重低于65 kg者，总剂量不超过1.5 mg/kg，最大剂量为100 mg。国内TUCC试验建议用量为50 mg（首先8 mg静脉注射，后42 mg在90分钟内静脉滴注）。配合肝素静脉应用（给药前肝素5 000 U静脉注射，继之以每小时1 000 U速率维持静脉滴注，以APTT结果调整肝素剂量，使APTT维持在50～70秒。(2) 肺栓塞：剂量为100 mg，2小时滴完。常用方法为10 mg在1～2分钟静脉注射，90 mg在2小时内静脉滴注。体重低于65 kg者，总剂量不超过1.5 mg/kg。(3) 急性缺血性脑卒中：必须经适当的影像学检查排除颅内出血之后，在急性缺血性脑卒中症状发生的3小时内进行治疗。推荐剂量为0.9 mg/kg，最大剂量为90 mg，总剂量的10%先从静脉注射，剩余剂量在随后60分钟持续静脉滴注。

【制剂与规格】注射用阿替普酶：① 10 mg；② 20 mg；③ 50 mg。

4.12.3 抗凝血药

4.12.3.1 肝素

肝素[基(基)，保(甲)]

Heparin

【适应证】用于防治血栓形成或栓塞性疾病（如心肌梗死，血栓性静脉炎，肺栓塞等），各种原因引起的弥散性血管内凝血，血液透析、体外循环、导管术、微血管手术等操作中及某些血液标本或器械的抗凝处理。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，如有过敏性疾病及哮喘病史，要进行易致出血的操作（如口腔手术等）者，已口服足量的抗凝血药者，月经量过多者，肝肾功能不全；出血性器质性病变；视网膜血管疾患，妊娠期妇女。(2)不可肌内注射给药。(3) 用药期间定期检测凝血时间，避免肌内注射其他药物。

【禁忌证】对本品过敏；有自发出血倾向者；血液凝固迟缓者（如血友病，紫癜，血小板减少）；外伤或术后渗血；先兆流产或产后出血者；亚急性感染性心内膜炎；海绵窦细菌性血栓形成；胃、十二指肠溃疡；严重肝肾功能不全；重症高血压；胆囊疾病及黄疸。

【不良反应】自发性出血倾向，有黏膜、伤口、齿龈渗血，皮肤瘀斑或紫癜，月经量过多等；严重时有内出血征象、麻痹性肠梗阻、咯血、呕血、血尿、血便及持续性头痛；偶见过敏反应，过量甚至可使心脏停搏。肌内注射可引起局部血肿，静脉注射可致短暂血小板减少症（肝素诱导血小板减少症）；长期使用有时反可形成血栓；ALT、AST升高。

【用法与用量】注射：(1) 成人常用量：①深部皮下注射，一次5 000～10 000 U，以后每8小时8 000～10 000 U或每12小时15 000～20 000 U，或根据凝血试验监测结果调整剂量。每24小时总量30 000～40 000 U。②静脉注射，首次5 000～10 000 U，之后，或按体重每4小时100 U/kg，用氯化钠注射液稀释后应用。③静脉滴注，一日20 000～40 000 U，加至氯化钠注射液1 000 ml中持续滴注。静脉滴注前应先静脉注射5 000 U作为初始剂量。(2) 预防性治疗：高危血栓形成患者，在外科手术前2小时5 000 U肝素皮下注射，但避免硬膜外麻醉，然后每隔8～12小时给5 000 U，共约7日。(3) 儿童常用量：①静脉注射，按体重一次50 U/kg，以后每4小时给予50～100 U。②静脉滴注，按体重50 U/kg，以后按体表面积24小时给予20 000 U/m^2，加至氯化钠注射液中缓慢滴注。

【制剂与规格】肝素钠注射液：① 2 ml：1 000 U；② 2 ml：5 000 U；③ 2 ml：12 500 U。

肝素钙注射液：① 0.2 ml：5 000 U；② 0.5 ml：12 500 U；③ 0.8 ml：20 000 U。

4.12.3.2 低分子肝素

依诺肝素

Enoxaparin

【适应证】用于预防静脉血栓栓塞性疾病，深静脉血栓（伴或不伴有肺栓塞），不稳定型心绞痛及非ST段抬高心肌梗死，血液透析体外循环中防止血栓形成。

【注意事项】(1) 肝功能不全患者应给予特别注意。(2) 肾功能损害时出血危险性增大。轻中度肾功能不全者，治疗时严密监测；严重肾功能不全时需要调整剂量，推荐剂量预防时一次2 000 U，一日1次，治疗时一次100 U/kg，一日1次。(3) 孕妇仅在必要时才可使用。(4) 哺乳期妇女使用时应停止哺乳。(5) 以下情况慎用，如止血障碍，肝肾功能不全者，消化道溃疡史，出血倾向的器官损伤史，近期出血性卒中，难控制的严重高血压，糖尿病性视网膜病变，近期接受神经或眼科手术和蛛网膜下腔／硬膜外麻醉。(6) 本品不推荐用于儿童。(7) 肾功能在正常范围内的老年人，预防性用药时无须调整剂量或一日用药次数。(8) 禁止肌内注射。(9) 使用前和使用中应监测血小板计数，如显著下降（低于原值的30%～50%），应停用本品。

【禁忌证】对肝素及低分子肝素过敏；严重的凝血障碍；低分子肝素或肝素诱导的血小板减少症史（以往有血小板计数明显下降）；活动性消化道溃疡；有出血倾向的器官损伤；急性感染性心内膜炎（心脏瓣膜置换术所致的感染除外）。以下情况不推荐使用：严重的肾功能损害；出血性脑卒中；难以控制的动脉高压；与其他药物共用（见药物相互作用）。

【不良反应】可见出血，部分注射部位瘀点、瘀斑；罕见注射部位坚硬炎性结节，局部或全身过敏反应，血小板减少症，免疫性血小板减少症伴有血栓形成，骨质疏松倾向，转氨酶升高。

【用法与用量】(1) 外科患者中预防静脉血栓栓塞性疾病：①中度血栓形成危险时，皮下注射一次2 000 U（0.2 ml），一日1次或一次4 000 U（0.4 ml），一日1次。②普外手术时，术前2小时给予第一次皮下注射。③高度血栓形成倾向时，推荐剂量为术前12小时开始给药，皮下注射一次4 000 U，一日1次（0.4 ml）。治疗一般持续7～10日。④某些患者适合更长的治疗周期，若有静脉栓塞倾向，应延长治疗至静脉血栓栓塞危险消除且患者不需卧床为止。⑤在矫形外科手术中，连续3周一日1次4 000 U是有益的。(2) 内科患者预防静脉血栓栓塞性疾病：皮下注射一次4 000 U(0.4 ml)，一日1次。治疗最短应为6日直至患者不需卧床为止，最长14日。(3) 伴有或不伴有肺栓塞的深静脉血栓：皮下注射一次150 U/kg，一日1次或一次100 U/kg，一日2次。合并栓塞性疾病时，一次100 U/kg，一日2次。疗程一般为10日。应在适当时开始口服抗凝药治疗，并应持续本品治疗直至达到抗凝治疗效果（INR：2～3）。(4) 不稳定型心绞痛及非ST段抬高的心肌梗死：皮下注射一次100 U/kg，12小时1次，应与阿司匹林同用（一日1次，100～325 mg）。推荐疗程最少为2日，至临床症状稳定。一般疗程为2～8日。(5) 血液透析体外循环中，防止血栓形成：一次100 U/kg。对于有高度出血倾向的血液透析患者，应减量至双侧血管通路给予低分子肝素50 U/kg或单侧血管通路75 U/kg。应于血液透析开始时，在动脉血管通路给予低分子肝素钠。上述剂量药物的作用时间一般为4小时。然而，当出现纤维蛋白环时，应再给予50～100 U/kg的剂量。

【制剂与规格】依诺肝素钠注射液：① 0.2 ml：2 000 U 抗Xa；② 0.4 ml：4 000 U 抗Xa；③ 0.6 ml：6 000 U 抗Xa；④ 0.8 ml：8 000 U 抗Xa；⑤ 1.0 ml：10 000 U 抗Xa。

那屈肝素

Nadroparin

【适应证】见依诺肝素。

【注意事项】(1) 肾功能不全时慎用。预防血栓栓塞时，严重肾功能损害患者剂量应减少25%；治疗血栓栓塞，不稳定型心绞痛和非ST段抬高心肌梗死时，轻中度肾功能损害剂量应减少25%。(2) 不建议妊娠期间使用本品，除非治疗益处超过

可能风险。(3) 不建议母乳喂养期间使用。(4) 以下情况慎用，如肝功能不全，肾功能不全，严重动脉性高血压，消化性溃疡病史，其他可能引起出血的器质性损伤，脉络膜-视网膜血管疾病，脑部、脊髓或眼科手术的术后期。(5)不能用于肌内注射。(6) 整个治疗过程中必须监测血小板计数。

【禁忌证】【不良反应】见依诺肝素。

【用法与用量】本品1 ml相当于9 500 U抗凝血因子Xa。(1)中度血栓栓塞形成危险的手术：皮下注射一次2 850 U (0.3 ml)，一日1次，大约在术前2小时进行第1次注射。(2) 高度血栓栓塞形成危险的手术：皮下注射，术前（如术前12小时)、术后（如术后12小时）及持续至术后第3日，剂量一日1次38 U/kg，术后第4日起剂量调整为一次57 U/kg，一日1次。可按表4-5决定剂量。(3) 已形成的深静脉栓塞：皮下注射，一次85 U/kg，12小时1次。使用时间不超过10日，应尽早使用口服抗凝药物。可按表4-6决定剂量。(4) 不稳定型心绞痛和非ST段抬高的心肌梗死：皮下注射，一次86 U/kg，12小时1次，联合使用阿司匹林（推荐在160 ~ 325 mg的负荷剂量后，口服剂量75 ~ 325 mg)。初始的86 U/kg剂量可通过一次性静脉注射和皮下注射给药。治疗时间一般在6日左右达到临床稳定。依据患者体重范围调整剂量（表4-7)。(5) 血液透析：对于无出血危险或血透持续4小时左右的患者，应在透析开始时通过动脉端单次注射大约65U/kg剂量。如有必要，可依据患者个体情况或血透技术条件调整使用剂量，如有出血危险，可将标准剂量减半（表4-8)。

表4-5 高度血栓栓塞形成危险的手术用药剂量

体重（kg）	从术前到术后第3日一日剂量(ml)	从第4日起一日剂量(ml)
< 51	0.2	0.3
51 ~ 70	0.3	0.4
> 70	0.4	0.6

表4-6 已形成的深静脉栓塞用药剂量

体重（kg）	一次剂量（ml）
40 ~ 49	0.4
50 ~ 59	0.5
60 ~ 69	0.6
70 ~ 79	0.7
80 ~ 89	0.8
90 ~ 99	0.9
≥ 100	1.0

表4-7 不稳定型心绞痛和非ST段抬高的心肌梗死用药剂量

体重（kg）	注射剂量（ml）	
	初始的一次性静脉注射	皮下注射（12小时1次）
< 50	0.4	0.4
51 ~ 59	0.5	0.5
60 ~ 69	0.6	0.6
70 ~ 79	0.7	0.7
80 ~ 89	0.8	0.8
90 ~ 99	0.9	0.9
≥ 100	1.0	1.0

表4-8 可依据患者体重范围调整使用剂量

体重（kg）	一次剂量（ml）
< 51	0.3
51 ~ 70	0.4
> 70	0.5

达肝素

Dalteparin

【适应证】用于急性深静脉血栓，血液透析和血液滤过期间防止凝血，不稳定型冠脉疾病（如不稳定型心绞痛、非ST段抬高心肌梗死)，预防手术相关血栓形成。

【注意事项】(1) 不推荐妊娠期妇女使用。(2) 以下情况慎用，如血小板减少症和血小板缺陷，严重肝肾功能不全，未控制的高血压，高血压性或糖尿病性视网膜病，近期手术后大剂量使用时，哺乳期妇女。(3) 禁止肌内注射。(4) 使用时须监测血小板计数。

【禁忌证】对本品或其他低分子肝素过敏；急性胃、十二指肠溃疡；急性脑出血；严重凝血系统疾病；脓毒性心内膜炎；中枢神经系统、眼部、耳部的损伤或手术；进行急性深静脉血栓治疗伴用局部麻醉。

【不良反应】可出现注射部位皮下血肿，暂时性轻微血小板减少症（Ⅰ型），暂时性AST、ALT升高；罕见皮肤坏死，脱发，过敏反应，注射部位以外的出血；很少见过敏样反应，严重的免疫介导型血小板减少症（Ⅱ型）伴动、静脉血栓或血栓栓塞。

【用法与用量】(1) 急性深静脉血栓：皮下注射，按体重一次200 U/kg，一日1次，一日总量不超过18 000 U；出血风险较高者，也可按体重一次100 U/kg，一日2次。持续静脉输注，初始剂量100 U/kg，每12小时可重复给药。可同时口服维生素K拮抗药，联合治疗至少需要5日。(2) 血液透析和血液滤过期间防止凝血：①慢性肾衰竭，患者无已知出血危险。若血液透析和血液过滤超过4小时，静脉快速注射30～40 U/kg体重，继以静脉输注每小时10～15 U/kg；若血液透析和血液过滤不超过4小时，剂量同上或静脉快速注射5 000 U。②急性肾衰竭，患者有高度出血危险：静脉快速注射5～10 U/kg，继以静脉输注每小时4～5 U/kg。(3) 不稳定型冠状动脉疾病（不稳定型心绞痛和非ST段抬高心肌梗死）：皮下注射，一次120 U/kg，一日2次。最大剂量为每12小时10 000 U。至少治疗6日，如有必要可以延长。此后推荐使用固定剂量治疗，直至进行血管重建。无禁忌证时，推荐同时使用低剂量阿司匹林。总治疗周期不超过45日，根据性别和体重选择剂量，女性＜80 kg和男性＜70 kg，每12小时皮下注射5 000 U；女性≥80 kg和男性≥70 kg，每12小时皮下注射7 500 U。(4) 预防与手术有关的血栓形成：中度血栓风险，术前1～2小时皮下注射2 500 U，术后一日早晨皮下注射2 500 U，直至可以活动，一般需5～7日或更长。高度血栓风险（患某些肿瘤的特定患者和某些矫形手术），术前晚间皮下注射5 000 U，术后每晚皮下注射5 000 U，持续至可以活动为止，一般需5～7日或更长。也可术前1～2小时皮下注射2 500 U，术后8～12小时皮下注射2 500 U，然后一日早晨皮下注射5 000 U。

【制剂与规格】达肝素钠注射液：① 0.2 ml：2 500 U 抗Xa；② 0.2 ml：5 000 U 抗Xa；③ 0.3 ml：7 500 U 抗Xa。

4.12.3.3 其他

华法林[保(甲)]

Warfarin

【适应证】用于预防及治疗深静脉血栓及肺栓塞，预防心肌梗死后血栓栓塞并发症（卒中或体循环栓塞），预防心房颤动、心瓣膜疾病或人工瓣膜置换术后引起的血栓栓塞并发症（卒中或体循环栓塞）。

【注意事项】(1) 少量华法林可由乳汁分泌，常规剂量对婴儿影响较小。(2) 老年人及妇女经期慎用。(3) 严格掌握适应证，在无凝血酶原测定的条件时，切不可滥用本品。(4) 本品个体差异较大，治疗期间应严密观察病情及出血，并依据凝血酶原时间、INR值调整用量，理想的应维持INR为2～3。(5) 严重出血可静注维生素K，必要时可输全血、血浆或凝血酶原复合物。(6) 本品起效缓慢，如需快速抗凝，先用肝素治疗后，开始华法林和肝素同时延续肝素最少5～7日直至INR在目标范围内2日以上，才可停用肝素。

【禁忌证】肝肾功能不全；未经治疗或不能控制的高血压；近期手术者；中枢神经系统或眼部手术；凝血功能障碍；最近颅内出血；活动性溃疡；感染性心内膜炎、心包炎或心包积液；活动性溃疡；外伤；先兆流产；妊娠期妇女。

【不良反应】出血：早期表现有瘀斑，紫癜，齿龈出血，鼻出血，伤口出血经久不愈，月经量过多等；肠壁血肿可致亚急性肠梗阻，硬膜下颅内血肿和穿刺部位血肿；偶见恶心、呕吐，腹泻，瘙痒性皮疹，过敏反应及皮肤坏死；罕见双侧乳房坏死，微血管病或溶血性贫血以及大范围皮肤坏疽。

【用法与用量】口服：成人常用量，前3日一日3～4 mg（年老体弱及糖尿病患者半量即可），3日后可给维持量一日2.5～5 mg。

【制剂与规格】华法林片：① 1 mg；② 2.5 mg；③ 3 mg；④ 5 mg。

磺达肝癸钠

Fondaparinux

【适应证】本品用于进行下肢重大骨科手术（如髋关节骨的、重大膝关节手术或者髋关节置换术等）患者预防静脉血栓栓塞事件的发生。无指征进行紧急（<120分钟）介入性治疗（PCI）的不稳定型心绞痛或非ST段抬高心肌梗死（UA/NSTEMI）患者使用溶栓或初始不接受其他形式再灌注治疗的ST段抬高心肌梗死患者的治疗。

【注意事项】(1) 不能通过肌内注射给予。(2) 出血风险增加的患者，如先天性或获得性出血异常（如血小板计数<50 000/mm^3）、胃肠道活动性溃疡疾病，以及近期颅内出血或脑、脊髓或眼科手术后不久患者，应谨慎使用。(3) 对于静脉血栓栓塞的防治，不应与任何能增加出血风险的药物合用。如地西卢定(Desirudin)、溶栓药物、GP Ⅱb/Ⅲa受体拮抗药、肝素或低分子肝素。其他抗血小板药物（乙酰水杨酸、双嘧达莫、噻氯匹定或氯吡格雷）及非甾体抗炎药物应慎用。(4) 对于不稳定型心绞痛／非ST段抬高心肌梗死和ST段抬高心肌梗死的患者，正在同时接受其他能增加出血风险的药物治疗（如GP Ⅱb/Ⅲa受体拮抗药或溶栓药）时，应慎用本药。(5) 老年患者由于肾功能通常随年龄增加而降低，出血风险会增加时，应慎用本药。(6) 预防静脉血栓栓塞-肌酐清除率<每分钟50 ml的患者出血风险增加，应谨慎使用。(7) 严重肝功能受损使用本药不需要进行剂量调整。(8) 除非明确需要，不应用于孕妇及哺乳期妇女。(9) 本品在17岁以下患者中的安全性和疗效尚没有研究。

【禁忌证】已知对磺达肝癸钠或本品中任何赋形剂成分过敏；具有临床意义的活动性出血；急性细菌性心内膜炎；肌酐清除率<每分钟20 ml的严重肾脏损害。

【不良反应】常见出血（血肿，血尿，咯血，齿龈出血）。不常见贫血，呼吸困难，皮疹，瘙痒。

【用法与用量】(1) 接受重大骨科手术的患者：磺达肝癸钠的推荐剂量为2.5 mg，一日1次，手术后皮下注射给药。假设手术后已经止血，初始剂量应在手术结束6小时后给予。治疗应持续直到静脉血栓栓塞的风险已减少，通常直至患者起床走动，至少术后5～9日。在接受髂关节手术的患者中，应延长预防使用磺达肝癸钠的时间，需再增加24日。(2) 不稳定型心绞痛／非ST抬高心肌梗死（US/NSTEMI）治疗：磺达肝癸钠的推荐剂量为2.5 mg，一日1次，皮下注射给药。做出诊断后应尽早开始治疗，治疗持续最长为8日，如果不到8日，出院则直至出院为止。(3) ST段抬高心肌梗死的治疗（STEMI）：磺达肝癸钠推荐剂量为2.5 mg，一日1次。磺达肝癸钠首剂应静脉内给药，随后剂量通过皮下注射给药。治疗应在诊断确立后尽早给药，治疗持续最长为8日，如果不到8日就出院则直至出院为止。在ST段抬高心肌梗死或不稳定型心绞痛／非ST抬高心肌梗死患者中，那些将接受冠状动脉旁路移植术（CABG）的患者中，如果可能的话，在手术前的24小时内不应该给予磺达肝癸钠，可以在手术后48小时再次开始给药。

【制剂与规格】磺达肝癸钠注射液：0.5ml：2.5 mg。

第 5 章 内分泌代谢疾病用药

本章包括下列常见疾病的治疗方案

- 糖尿病
- 甲状腺功能亢进症
- 甲状腺功能减退症
- 肢端肥大症
- 高催乳素血症
- 尿崩症
- 腺垂体功能减退症
- 嗜铬细胞瘤
- 原发性醛固酮增多症
- 库欣综合征
- 甲状旁腺功能亢进症
- 甲状旁腺功能减退症
- 骨质疏松症

5.1 糖尿病及其药物治疗

糖尿病是以慢性高血糖为特征的一组异质性代谢性疾病，由胰岛素分泌缺陷和（或）胰岛素作用缺陷所引起，以慢性高

血糖伴糖类、脂肪和蛋白质的代谢障碍为特征。临床表现典型时，患者往往已出现空腹高血糖症；而临床表现不显著时，则于葡萄糖耐量受损后被确诊；故依据空腹血糖浓度或随机血糖浓度和（或）葡萄糖耐量试验可进行诊断。

大部分糖尿病患者可按照病因、发病机制分为1型和2型糖尿病。1型糖尿病的主要病因是由于自身免疫对胰岛β细胞破坏后造成胰岛素分泌的绝对缺乏，故1型糖尿病患者需要胰岛素治疗来维持生命。2型糖尿病的发生是由于胰岛素分泌减少或是胰岛素抵抗，可表现为以胰岛素抵抗为主伴胰岛素相对缺乏，或胰岛素分泌缺陷为主伴或不伴胰岛素抵抗。

糖尿病是心血管疾病的重要危险因素，是冠心病的等危症，控制1型和2型糖尿病患者的血糖至最佳水平可以减少糖尿病血管并发症的发生风险。糖尿病治疗的目的在于减轻症状并将各种并发症的发生风险降到最低，故糖尿病必须严格控制，可用糖基化血红蛋白（HbA1c）作为2～3个月血糖控制的指标。患者可通过控制饮食、减轻体重、加强运动、口服降糖药和（或）应用胰岛素控制血糖，治疗过程中要注意避免发生低血糖，特别是患糖尿病并接受胰岛素治疗的司机应警惕严重低血糖的发生并应采取防治措施，如在车内准备糖或食物，并应确保能找到可替换的司机。

糖尿病血糖控制不好时会出现急性并发症如糖尿病酮症酸中毒（diabetic ketoacidosis，DKA）和高渗性高血糖状态(hyperosmolar hyperglycemic state，HHS)；慢性并发症包括大血管和微血管病变，大血管病变如动脉粥样硬化、冠心病、高血压、脑血管疾病、周围血管疾病、糖尿病足等；微血管病变如糖尿病肾病、糖尿病视网膜病变、糖尿病神经病变等。

5.1.1 血糖调节药

胰岛素（Insulin）根据其来源和化学结构可分为动物胰岛素、人胰岛素和胰岛素类似物。胰岛素类似物（Insulin Similitude）是利用重组DNA技术，对人胰岛素的氨基酸序列进行修饰而生成的，它们具有与普通胰岛素不同的结构、理化性质和药动学特征，在模拟正常生理性胰岛素分泌及减少低血糖发生的危险性方面要优于动物胰岛素和人胰岛素。

胰岛素根据其作用时间及特点可分为速效人胰岛素类似物、短效（正规）胰岛素、中效胰岛素、长效胰岛素（包括长效人胰岛素类似物）和预混胰岛素。

（1）速效人胰岛素类似物：有门冬胰岛素和赖脯胰岛素，它们具有达到峰值更快，控制餐后血糖水平以及低血糖发生率低的优点。

（2）短效胰岛素制剂：有普通（正规）胰岛素，其中人胰岛素较动物胰岛素起效快、作用时间长。

（3）中效胰岛素制剂：有低精蛋白锌胰岛素，其起效较短效者为慢，但产生低血糖的危险较短效制剂小，同时血液中始终保持一定浓度的胰岛素，对胰岛素基础分泌量低的患者控制血糖波动比较有利。

（4）长效胰岛素制剂：有精蛋白锌胰岛素，起效较中效者更慢，但持久，使用中可减少注射次数，但由于是混悬液剂型，可能造成吸收和药效的不稳定。

（5）超长效人胰岛素制剂类似物：有甘精胰岛素和地特胰岛素，具有长效、平稳的特点，无峰值，低血糖发生率少，更适合用于基础胰岛素替代治疗。

（6）预混胰岛素制剂：是指含有中效和短效胰岛素制剂的混合物，可同时具有短效和中效胰岛素制剂的作用。特点是使用方便，可减少注射时混合可能造成的剂量不准确及避免相对较复杂的操作；缺点是由于是预混，只有有限的混合方案，对于一些比较特殊的混合要求难以达到。

胰岛素根据给药装置可分为普通胰岛素注射液和胰岛素笔芯注射液，后者需放入胰岛素笔注射器中使用，用胰岛素笔注射的优点是可进行更加精确的剂量调整、携带方便，同时减轻注射部位的疼痛感，但相对费用较高。

胰岛素[基（基），保（乙）]

Insulin

【适应证】①1型糖尿病。②2型糖尿病重度、消瘦营养不良者。③轻、中

度2型糖尿病经饮食和口服降血糖药治疗无效者。④糖尿病合并严重代谢紊乱（如酮症酸中毒、高渗性昏迷或乳酸酸中毒）、重度感染、消耗性疾病（如肺结核、肝硬化）和进行性视网膜、肾、神经等病变及急性心肌梗死、脑血管意外者；合并妊娠、分娩及大手术者。⑤胰岛素与葡萄糖同时输注，可促使钾离子从细胞外液进入组织细胞内，而纠正高钾血症和细胞内缺钾。

【注意事项】(1) 短效胰岛素皮下吸收峰型较速效人胰岛素类似物宽，与人正常胰岛素生理分泌模式有一定差异；短效胰岛素的缺点是餐前30分钟用药不易把握，进餐时间提前容易导致血糖控制不佳，进餐时间延后容易发生低血糖，血糖波动较大。(2) 注射部位可有皮肤发红、皮下结节和皮下脂肪萎缩等局部反应，故须经常更换注射部位。(3) 只有可溶性短效胰岛素才可以静脉给药。(4) 低血糖患者忌用。(5) 胰岛素贮藏条件的差异：未开瓶使用的胰岛素注射液应在2～10℃冷藏保存；已开瓶使用的胰岛素注射液可在室温（最高25℃）保存最长4～6周；使用中的胰岛素笔芯注射液不要放在冰箱里，室温最长保存4周；冷冻后的胰岛素不可使用。(6) 为了防止血糖突然下降，患者来不及呼救而失去知觉，应给每一位患者随身带上记有病情及用胰岛素情况的卡片，以便能不失时机地进行及时抢救处理。发生低血糖时可进食，严重低血糖时可静脉注射50%葡萄糖注射液，必要时再静脉滴注5%或10%葡萄糖注射液。

【禁忌证】对本品过敏者、低血糖症者。

【不良反应】低血糖反应；频繁发生或严重的低血糖症可引起中枢神经系统不可逆损害、致死或致残；少数患者对人胰岛素制剂发生过敏反应，偶见过敏性休克；极少数患者发生胰岛素耐药性；也有患者可因钠潴留发生轻度水肿、在注射部位呈现皮下脂肪萎缩或增生等。

【用法与用量】使用方法及剂量应个体化。内分泌及糖尿病专家建议：1型糖尿病患者通常应采用一日多次的胰岛素注射方案或持续皮下泵胰岛素输注方案；选择用基础胰岛素控制夜间和空腹血糖，而进餐前则予以餐前注射胰岛素来模拟β细胞的快速胰岛素分泌模式；全天胰岛素总量（TDI）= 体重（kg）×0.5 U，其中基础胰岛素总量为40%，餐时胰岛素总量为60%；早餐前的胰岛素剂量往往要大于中餐及晚餐前的胰岛素剂量；要根据血糖水平监测结果来调整胰岛素用量。2型糖尿病患者可使用口服降糖药联合胰岛素治疗方案或与单独使用、类似1型糖尿病患者使用的胰岛素治疗方案进行治疗，但应根据病情和病程进行调整。

【制剂与规格】普通（正规）胰岛素注射剂：10 ml : 400 U。

胰岛素笔芯注射剂：3ml : 300 U。

常规重组人胰岛素注射剂：10 ml : 400 U。

常规重组人胰岛素笔芯注射剂：3 ml : 300 U。

70/30混合重组人胰岛素注射剂：① 10 ml : 1 000 U；② 3 ml : 300 U。

50/50混合重组人胰岛素注射剂：3 ml : 300 U。

高血糖素[保(乙)]

Glucagon

【适应证】(1) 盐酸高血糖素刺激c-肽试验用于评估糖尿病患者胰岛β细胞的最大分泌情况。(2) 用于处理糖尿病患者发生的低血糖反应。(3) 进行胃肠道检查时用于暂时抑制胃肠道蠕动。

【注意事项】(1) 当肝糖原存在时，盐酸高血糖素可治疗低血糖。若为空腹、血浆肾上腺素水平低下、慢性低血糖、或饮酒过多而致的低血糖，则盐酸高血糖素作用可很小或无效。(2) 盐酸高血糖素与胰岛素作用相反，糖尿病者或有心脏病的老年人，在内镜和造影中若使用本品应格外小心。(3) 患有释放盐酸高血糖素和胰岛素的肿瘤的患者，应慎用。(4) 如溶液呈现凝胶状或出现了不溶性粉末，请勿使用。

【禁忌证】对盐酸高血糖素或其他成分过敏者，或有肾上腺肿瘤者禁用。

【不良反应】罕见严重的不良反应。偶见恶心、呕吐，特别是剂量超过1 mg或注射过快（少于1分钟）时，可能会出现暂时心跳加速。少数患者可能会有变态

反应。

【用法与用量】(1) β 细胞分泌能力的评估：患者空腹时静脉注射 1 mg，注射前和注射后 6 分钟测定血浆 c- 肽水平。如空腹血糖浓度低于 7 mmol/L，则试验结果难以评估。(2) 糖尿病患者的低血糖治疗：立即皮下或大腿外上侧肌内注射，全量为 1 mg（成人或体重 > 25 kg 的儿童），半量为 0.5 mg（体重 < 25 kg 或 6 ~ 8 岁的儿童）。药物起效后，应尽快给予口服糖以防止低血糖的复发。如患者在用药后 10 分钟内无效，应静脉注射葡萄糖。如果有效，应给予口服糖类以恢复肝糖原的储备和预防低血糖的复发。(3) 胃肠道检查：依据诊断技术和给药途径的不同，剂量范围为 0.2 ~ 2 mg。

【制剂与规格】注射用盐酸高血糖素：① 1 mg（附溶媒 1 ml）；② 10 mg（附溶媒 10 ml）。

5.1.1.1 短效胰岛素

普通胰岛素[保(甲)]

Regular Insulin

普通胰岛素也称正规胰岛素

【适应证】见胰岛素。是唯一可供静脉注射的制剂，用于抢救糖尿病酮症酸中毒和高血糖高渗性昏迷的患者。

【注意事项】(1) 人胰岛素比动物胰岛素起效快，作用时间长。动物胰岛素皮下注射，0.5 ~ 1 小时起效，2 ~ 4 小时达峰，作用时间维持 6 ~ 8 小时；人胰岛素皮下注射，0.5 小时内起效，1 ~ 3 小时达峰，作用时间维持大约 8 小时。(2) 不同部位皮下注射的吸收差别很大。(3) 静脉注射后 10 ~ 30 分钟起效，10 ~ 30 分钟达高峰，持续 0.5 ~ 1 小时，在血液循环中半衰期 ($t_{1/2}$) 为 5 ~ 10 分钟。(4) 其余见胰岛素。

【禁忌证】【不良反应】见胰岛素。

【用法用量】使用方法及剂量应个体化，见胰岛素。

【制剂】普通（正规）胰岛素注射剂：10 ml : 400 U。

胰岛素笔芯注射剂：3 ml : 300 U。

5.1.1.2 中效胰岛素

低精蛋白锌胰岛素[保(甲)]

Isophane Insulin

低精蛋白锌胰岛素是将胰岛素与锌和鱼精蛋白磷酸缓冲液混合制成的混悬剂，故作用时间延长，为中效胰岛素。皮下注射平均 1.5 小时起效，4 ~ 12 小时达峰，作用时间维持 18 ~ 24 小时。与长效胰岛素相比，其释放曲线的变异较小。优点是皮下注射后缓慢平稳释放，引起低血糖的危险较短效制剂小，同时血液中始终保持一定浓度的胰岛素，故对胰岛素基础分泌量低的患者控制血糖波动比较有利。

【适应证】见胰岛素。但因属中效胰岛素，故一般与短效胰岛素配合使用，以提供胰岛素的日基础用量。

【注意事项】低精蛋白锌胰岛素不可静脉注射，其他见胰岛素。

【禁忌证】【不良反应】见胰岛素。

【用法与用量】中效胰岛素最常用于皮下胰岛素强化治疗方案中睡前注射，以控制空腹血糖。也可一日 1 次，早餐前给药；或者一日 2 次于早餐前和睡前给药，使用方法及剂量应个体化。皮下注射使用前需注意将药物混匀，但不可用力摇动，以免产生气泡；如需与普通胰岛素混合使用，应在注射前先抽取普通胰岛素，后抽取低精蛋白锌胰岛素。

【制剂与规格】低精蛋白锌胰岛素注射剂：10 ml : 400 U。

低精蛋白锌胰岛素笔芯注剂：3 ml : 300 U。

低精蛋白锌重组人胰岛素笔芯注射剂：10 ml : 1 000 U。

5.1.1.3 长效胰岛素

精蛋白锌胰岛素

Protamine Zinc Insulin

精蛋白锌胰岛素是在低精蛋白锌的基础上加大鱼精蛋白的比例，使其更接近人的体液 pH，溶解度更低，释放更加缓慢，作用持续时间更长。皮下注射后 3 ~ 4 小时起效，12 ~ 20 小时达峰，作用时间维持 24 ~ 36 小时。

【适应证】见胰岛素。因属长效胰岛素，故一般和短效胰岛素配合使用。

【注意事项】(1) 长效胰岛素的特点是可减少注射次数，但由于长效制剂多是混悬液剂型，因此可能造成注射后的吸收和药效不稳定；使用前轻轻摇动使药物混匀。(2) 因作用缓慢，不能用于抢救糖尿病酮症酸中毒及高渗性昏迷。(3) 不能用于静脉注射。(4) 与普通胰岛素混合使用时，应先抽取普通胰岛素。其他见胰岛素。

【禁忌证】【不良反应】见胰岛素。

【用法与用量】使用方法及剂量应个体化，长效胰岛素一般一日皮下注射 1 次，以满足糖尿病患者的基础胰岛素需要量。剂量根据病情而定，可于一日早餐前 0.5 小时皮下注射 1 次，一日用量一般为 10 ~ 20 U。

【制剂与规格】精蛋白锌胰岛素注射剂：10 ml : 400 U。

精蛋白锌重组人胰岛素注射剂：3 ml : 300 U。

5.1.1.4 预混胰岛素

预混胰岛素 30 R、50 R、70/30、50/50 [保（乙）]

预混胰岛素是指含有两种胰岛素的混合物，可同时具有短效和中效胰岛素的作用。制剂中的短效成分起效迅速，可以较好地控制餐后高血糖，中效成分持续缓慢释放，主要起替代基础胰岛素分泌作用。预混胰岛素含有标示百分比的短效胰岛素和中效胰岛素，如 30 R、70/30 是 70% 中效人胰岛素混悬液与 30% 人普通胰岛素的混合制剂；50 R、50/50 是 50% 中效人胰岛素混悬液与 50% 人普通胰岛素的混合制剂等，其作用相当于短效和中效胰岛素的叠加；由于 50 R 的短效胰岛素的含量相对高一些，其控制餐后高血糖的作用较 30 R 制剂强。30 R 预混胰岛素皮下注射后 0.5 小时内起效，2 ~ 8 小时达峰，作用时间最长持续 24 小时；50 R 预混胰岛素皮下注射后 0.5 小时内起效，2 ~ 12 小时达峰，作用时间最长持续 16 ~ 24 小时。

【适应证】【禁忌证】【不良反应】【注意事项】见胰岛素。

【用法与用量】预混胰岛素的剂量根据病情而定，一般于早饭前半小时皮下注射 1 次，有时需要于晚餐前再注射 1 次。预混胰岛素为混悬液，不能静脉注射。

【制剂与规格】精蛋白锌生物合成人胰岛素注射剂（预混 30 R）：含 30% 的短效（R）和 70% 的中效（N）胰岛素。精蛋白锌生物合成人胰岛素注射剂（预混 50 R）：含 50% 的短效（R）和 50% 的中效（N）胰岛素。精蛋白锌重组人胰岛素混合 70/30 注射剂：含 30% 的短效（R）和 70% 的中效（N）胰岛素。精蛋白锌重组人胰岛素混合 50/50 注射剂：含 50% 的短效（R）和 50% 的中效（N）胰岛素。

注射剂：① 10 ml : 400 U；② 3 ml : 300 U。

笔芯注射剂：3 ml : 300 U。

5.1.1.5 胰岛素类似物

胰岛素类似物由于改变了组成胰岛素的氨基酸的分子结构，具有类似胰岛素的降糖作用，但在发挥作用的时间、体内的代谢速度等方面与人胰岛素有很大区别，因而能够更好地模拟生理性胰岛素分泌模式并减少低血糖发生风险。人体生理性胰岛素分泌包括餐时和基础分泌两部分，胰岛素类似物也按药效动力学分为速效、长效和预混三类。目前已经用于临床的有门冬胰岛素和赖脯胰岛素两种速效胰岛素类似物，甘精胰岛素和地特胰岛素两种长效胰岛素类似物，门冬胰岛素 30、赖脯胰岛素 25 和赖脯胰岛素 50 三种预混胰岛素类似物。

5.1.1.5.1 速效胰岛素类似物

门冬胰岛素 [保（乙）]

Insulin Aspart

门冬胰岛素是用天门冬氨酸取代人胰岛素 B 链 28 位的脯氨酸，皮下注射后局部吸收更快，药动学特点更符合生理性的餐时胰岛素分泌和血糖变化谱，可以更好地控制餐后血糖，减少低血糖的发生。

【适应证】属速效胰岛素，可用于胰岛素泵治疗；2 岁以上儿童和青少年糖尿病患者以及妊娠合并糖尿病患者。

【注意事项】与普通短效胰岛素相比，其吸收速度快、起效迅速、作用持续时间短。皮下注射后 10 ～ 20 分钟起效，40 分钟达峰，降糖作用持续 3 ～ 5 小时。一般须紧邻餐前或餐后立即注射，用药 10 分钟内须进食含糖类的食物，如果注射后不进食或者进食时间延后将导致低血糖的发生，而且发生时间比普通胰岛素早。

【禁忌证】低血糖症。

【不良反应】 见胰岛素。

【用法与用量】皮下注射，根据血糖情况调整剂量，与中效胰岛素合用可控制晚间或晨起高血糖，有更少的低血糖风险。

【制剂与规格】门冬胰岛素特充注射液：3 ml : 300 U。

门冬胰岛素笔芯注射液：3ml : 300 U。

赖脯胰岛素 [保(乙)]

Insulin Lispro

赖脯胰岛素是由人胰岛素 B 链 28 位的脯氨酸与 29 位的赖氨酸互换而成，可加速皮下注射后的吸收，有利于控制餐后迅速升高的高血糖。

【适应证】属速效胰岛素，建议使用年龄为 12 岁以上。

【注意事项】皮下注射后 15 ～ 20 分钟起效，30 ～ 60 分钟达峰值，降糖作用持续 4 ～ 5 小时。可替代普通胰岛素，发挥速效降糖作用；也可与精蛋白结合作为中效制剂。

【禁忌证】【不良反应】见胰岛素。

【用法与用量】可于临餐前或餐后立即皮下注射。

【制剂与规格】重组赖脯胰岛素注射液：3 ml : 300 U。

5.1.1.5.2 长效胰岛素类似物

甘精胰岛素 [保(乙)]

Insulin Glargine

甘精胰岛素为长效胰岛素类似物，在人胰岛素 B 链的 C 端增加两个氨基酸，A 链 21 位用甘氨酸替换了天门冬氨酸，使其保持结构稳定。注射后持续长时间缓慢释放而延长作用时间，可模拟生理性基础胰岛素分泌，良好控制血糖，减少低血糖风险，减少胰岛素治疗相关的体重增加。具有长效、平稳的特点，无峰值血药浓度，属一日用药 1 次的长效制剂。

【适应证】用于基础胰岛素替代治疗。一般也和短效胰岛素或口服降糖药配合使用。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见胰岛素。

【用法与用量】一日注射 1 次，模拟生理性基础胰岛素分泌，一般为一日傍晚注射 1 次，满足糖尿病患者的基础胰岛素需要量。皮下注射起效时间为 1.5 小时，较中效胰岛素慢，有效作用时间 22 小时左右，几乎没有峰值出现，作用平稳。本品不能用于胰岛素泵，也绝不能静脉注射。

【制剂与规格】重组甘精胰岛素注射液：3 ml : 300 U。

地特胰岛素 [保(乙)]

Insulin Detemir

地特胰岛素为长效胰岛素类似物，是将人胰岛素 B 链 30 位的苏氨酸去掉，在 B 链 29 位的赖氨酸上酰化一个 14 碳的脂肪酸侧链。注射后持续长时间缓慢释放而延长作用时间，可模拟生理性基础胰岛素分泌，良好控制血糖，减少低血糖风险，减少胰岛素治疗相关的体重增加。

【适应证】适用于基础胰岛素替代治疗。一般也和短效胰岛素或口服降糖药配合使用。

【注意事项】作用平缓且持续时间长。皮下注射 2 小时起效，6 ～ 8 小时后达到最大血清浓度，作用时间长达 24 小时；当每日注射 2 次时，注射 2 ～ 3 次后达到稳态血清浓度。本品吸收的个体内变异低于其他基础胰岛素制剂，引起的体重增加也少。本品不能用于胰岛素泵，也绝不能静脉注射。

【用法用量】应用于口服降糖药联合基础胰岛素治疗及基础 - 餐时胰岛素治疗两种模式，前者即在继续口服降糖药物治疗基础上，联合长效胰岛素类似物睡前注射，后者治疗时长效胰岛素类似物作为基础胰岛素于睡前注射，两种治疗均根据患者空腹血糖水平调整胰岛素用量；用量因

人而异，初始治疗方案为一日注射 1 或 2 次，起始剂量为 10 U 或 0.1 ~ 0.2 U/kg。

【制剂与规格】地特胰岛素笔芯注射液：3 ml : 300 U。

地特胰岛素特充注射液：3 ml : 300 U。

5.1.1.5.3 预混胰岛素类似物

门冬胰岛素 30 注射液[保(乙)]

Insulin Aspart 30 Injection

本品含 30% 可溶性门冬胰岛素和 70% 精蛋白门冬胰岛素，其作用相当于速效及中效胰岛素的叠加。

【适应证】参见胰岛素。用于治疗 1 型和 2 型糖尿病。本品不宜用于治疗糖尿病酮症酸中毒或高渗性昏迷等急性并发症。

【注意事项】(1) 本品不可静脉注射。(2) 使用前将笔芯上下摇动 10 次以使其中的药液呈均匀雾状混悬液，如未达到均匀雾状混悬液则重复上述动作直至达到为止。容器内的小玻璃珠有助于药液的混匀。不得剧烈振摇笔芯，否则产生的泡沫将影响剂量的准确性。本品皮下注射后 10 ~ 20 分钟起效，达峰时间 60 分钟，作用最强时间 1 ~ 4 小时，持续时间可达 24 小时。半衰期平均为 8 ~ 9 小时。

【不良反应】【禁忌证】参见胰岛素。

【用法与用量】一日早餐前 0 ~ 10 分钟皮下注射 1 次，一般从 1 个预定小剂量开始（例如 4 ~ 8 U），根据血糖变化调整剂量。有时需于晚餐前再注射 1 次，起始剂量可用早上剂量的 1/2 或相当，以后按需调整。

【制剂与规格】门冬胰岛素 30 笔芯注射液：3 ml : 300 U。

5.1.2 口服降糖药

口服降糖药治疗是基于 2 型糖尿病的两个主要异常病理生理改变，即胰岛素抵抗和胰岛素分泌受损。口服降糖药多用于治疗 2 型糖尿病。

根据作用机制，口服降糖药的分类如下。

(1) 促胰岛素分泌药

①磺酰脲类促胰岛素分泌药：如格列本脲、格列齐特、格列喹酮、格列吡嗪和格列美脲。

②非磺酰脲类促胰岛素分泌药：如瑞格列奈、那格列奈。

(2) 非促胰岛素分泌药

①双胍类药：如二甲双胍，可减少糖原生成和增加葡萄糖的外周利用而降低血糖。

② α-葡萄糖苷酶抑制药：如阿卡波糖，伏格列波糖，它们通过抑制 α-葡萄糖苷酶的活性而减少淀粉的消化和吸收而降低血糖。

③胰岛素增敏药：如罗格列酮和吡格列酮，它们可以改善外周性胰岛素抵抗而降低血糖。可单独使用，也可与二甲双胍或磺酰脲类药合用。

5.1.2.1 促胰岛素分泌药

5.1.2.1.1 磺酰脲类促胰岛素分泌药

格列本脲[基(基), 保(甲)]

Glibenclamide

【适应证】用于轻、中度 2 型糖尿病。

【注意事项】(1) 体质虚弱、高热、恶心和呕吐、甲状腺功能亢进症、老年人慎用。(2) 用药期间应定期测血糖、尿糖、尿酮体、尿蛋白和肝、肾功能，并进行眼科检查等。(3) 乙醇本身具有致低血糖作用，可延缓本品的代谢。与乙醇合用，可引起腹痛、恶心、头痛、呕吐、面部潮红，且更易发生低血糖反应，用药期间应忌酒。

【禁忌证】(1) 1 型糖尿病、糖尿病低血糖昏迷、酮症酸中毒者。(2) 严重的肾或肝功能不全者。(3) 妊娠及哺乳期妇女。(4) 对本品及其他磺酰脲类、磺胺类或赋形剂过敏者。

【不良反应】常见腹泻、恶心、呕吐、头痛、胃痛或胃肠不适；少见皮疹、严重黄疸、肝功能损害、骨髓抑制、粒细胞减少、血小板减少症等。

【用法与用量】口服：一般患者开始一次 2.5 mg，早餐前服用；或一日 2 次，早餐及晚餐前各 1 次。轻症者一次 1.25 mg，一日 1 ~ 2 次，早、晚餐前服。用药 7 日后剂量递增（一周增加 2.5 mg）。

一般用量为一日 5 ~ 10 mg，最大用量一日不超过 15 mg。

【制剂与规格】格列本脲片：2.5 mg。

格列喹酮 [保（乙）]

Gliquidone

【适应证】用于 2 型糖尿病。

【注意事项】(1) 糖尿病合并肾病者，当肾功能轻度异常时尚可使用，但严重肾功能不全时，则应改用胰岛素治疗。(2) 治疗中若出现不适，如低血糖、发热、皮疹、恶心等应从速就医，一旦发生皮肤过敏反应应停用本品。(3) 与其他不同药物合用可能升高或降低血糖水平。(4) 本品可减弱病人对乙醇的耐受力，而乙醇亦可能增强本品的降血糖作用。

【禁忌证】(1) 1 型糖尿病、糖尿病低血糖昏迷或昏迷前期、糖尿病合并酮症酸中毒、晚期尿毒症者。(2) 对本品及磺胺药过敏者。(3) 妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】有极少数报道皮肤过敏、胃肠道反应、轻度低血糖反应及血液系统改变。

【用法与用量】口服：应在餐前 30 分钟服用。一般日剂量为 15 ~ 120 mg，酌情调整，通常日剂量为 30 mg 以内者可于早餐前一次服用；更大剂量应分 3 次，分别于餐前服用；最大日剂量不得超过 180 mg。

【制剂与规格】格列喹酮片：30 mg。

格列吡嗪 [基（基），保（甲／乙）]

Glipizide

【适应证】经饮食控制及体育锻炼 2 ~ 3 个月疗效不满意的轻、中度 2 型糖尿病，但此类患者的胰岛 β 细胞需有一定的分泌功能且无急性并发症，不合并妊娠、无严重的慢性并发症。

【注意事项】(1) 患者用药时应遵医嘱，注意饮食、剂量和用药时间。(2) 治疗中注意早期出现的低血糖症状，应及时采取措施，静脉滴注葡萄糖注射液。(3) 必须在进餐前即刻或进餐中服用；治疗时不定时进餐或不进餐会引起低血糖。(4) 肝、肾功能不全者会影响本品的排泄，增加低血糖反应发生的危险，应慎用。(5) 虚弱或营养不良者应慎用。(6) 65 岁以上老年人达稳态时间较年轻人延长 1 ~ 2 日。(7) 控释片需整片吞服，不能嚼碎掰开和碾碎。(8) 对严重胃肠道狭窄的患者（病理性或医源性）应慎用。(9) 普通片对体质虚弱、高热、恶心、呕吐、有肾上腺皮质功能减退或腺垂体功能减退症者慎用。(10) 避免饮酒，以免引起戒断反应。

【禁忌证】(1) 1 型糖尿病、糖尿病低血糖昏迷或昏迷前期、糖尿病合并酮症酸中毒、晚期尿毒症者。(2) 严重烧伤、感染、外伤和大手术、肝肾功能不全者、白细胞减少者。(3) 对本品及磺胺药过敏者。(4) 妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】低血糖症，偶见 ALT 及 AST、乳酸脱氢酶、碱性磷酸酶、血尿素氮、血肌酐轻至中度升高。

【用法与用量】口服：治疗剂量因人而异，根据血糖监测调整剂量。(1) 控释片：常用起始剂量为一日 5 mg，与早餐同服；使用本品 3 个月后测定糖化血红蛋白，若血糖未能满意控制可加大剂量；多数患者一日服 10 mg，部分患者需 15 mg，最大日剂量 20 mg。(2) 普通片：一般推荐剂量为一日 2.5 ~ 20 mg，早餐前 30 分钟服用；初始剂量一日 2.5 ~ 5 mg，逐渐调整至合适剂量；日剂量超过 15 mg 时，应分成 2 ~ 3 次，餐前服用。(3) 老年、体弱或营养不良者、肝肾功能损害者的起始和维持剂量均应采取保守原则，以避免低血糖发生。

【制剂与规格】格列吡嗪片：① 2.5 mg；② 5 mg。

格列吡嗪控释片：5 mg。

格列齐特 [保（乙）]

Gliclazide

【适应证】单用饮食疗法、运动疗法和减轻体重不足以控制血糖水平的成人 2 型糖尿病患者。

【注意事项】肝功能不全或严重肾功能不全者慎用。应用本品应定时进餐，注意防止低血糖发生。因本品有缓释片和普通片剂，当用格列齐特缓释片 30 mg 代替格列齐特 80 mg 时，两种规格剂量作用相当，替代时必须监测血糖。若用格列齐特

缓释片代替其他口服降糖药，应考虑先前使用药物的降糖强度和代谢半衰期，以免药物累加引起低血糖风险。

【禁忌证】(1) 1型糖尿病、糖尿病低血糖昏迷或昏迷前期、糖尿病合并酮症酸中毒、晚期尿毒症者。(2) 严重烧伤、感染、外伤和大手术、严重肝肾功能不全者、白细胞减少者。(3) 对本品、其他磺酰脲类及磺胺药过敏者。(4) 应用咪康唑治疗者。(5) 妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见低血糖；少见胃肠道功能障碍如腹痛、恶心、呕吐、消化不良、腹泻、便秘；罕见皮疹、瘙痒、荨麻疹、红斑、斑丘疹、肝转氨酶水平增高、肝炎等；极罕见贫血、白细胞减少、血小板减少、粒细胞减少等；暂时性视力障碍。

【用法与用量】口服：(1) 缓释片。①首次建议剂量为一日 30 mg，于早餐时服用；如血糖水平控制不佳，剂量可逐次增至一日 60 mg、90 mg 或 120 mg，一次增量间隔至少4周（如治疗2周后血糖仍无下降时除外），最大日剂量为 120 mg。② 65岁以上患者开始治疗时一日1次，一次 30 mg。③高危患者，如病情严重或代偿功能较差的腺垂体功能减退症、甲状腺功能减退症、肾上腺功能减退症、长期和（或）大剂量肾上腺皮质激素治疗后撤停、严重冠心病、颈动脉严重受损、弥漫性血管病变等建议以一日 30 mg 的最小剂量开始治疗。(2)普通片，开始时一日2次，初始日剂量为 40 ~ 80 mg，连服 2 ~ 3 周，然后根据血糖水平调整用量；一般一日剂量为 80 ~ 240 mg，最大日剂量不超过 240 mg。

【制剂与规格】格列齐特片：80 mg。
格列齐特缓释片：30 mg。

格列美脲[保(乙)]

Glimepiride

【适应证】用于食物、运动疗法及减轻体重均不能满意控制血糖的2型糖尿病患者。

【注意事项】(1) 必须在进餐前即刻或进餐中服用，不定时进餐或不进餐会引起低血糖。(2) 定期监测血糖、尿糖、糖化血红蛋白、肝功能和血液学白细胞和血小板计数检查。

【禁忌证】1型糖尿病、糖尿病低血糖昏迷、酮症酸中毒、严重的肾或肝功能损害者、妊娠期、哺乳期妇女禁用。对本品、其他磺脲类、磺胺类或赋形剂过敏者禁用。

【不良反应】可出现 ALT 及 AST 升高，极个别肝功能损害病例如胆汁淤积和黄疸可能进展；可出现皮肤过敏，瘙痒、皮疹、荨麻疹、对光过敏；个别有血钠降低；少见恶心、呕吐、腹泻、胃内压迫或饱胀感和腹痛；罕见中度血小板、白细胞、粒细胞、红细胞减少症，溶血性贫血和全血细胞减少。

【用法与用量】口服：起始剂量一次 1 mg，一日1次顿服；建议早餐前不久或早餐中服用，若不进早餐则于第一次正餐前不久或餐中服用；以适量的水整片吞服；如漏服一次，不能以加大下次剂量来纠正。如血糖控制不满意，可每隔 1 ~ 2 周逐步增加剂量至一日 2 mg、3 mg、4 mg，最大推荐剂量为一日 6 mg。从其他口服降糖药改用本品时，一般考虑原使用药物的降糖强度和血浆半衰期，以免药物累加引起低血糖反应风险；从胰岛素改用本品应在医生严密监测下进行。

【制剂与规格】格列美脲片：① 1 mg；② 2mg。

5.1.2.1.2 非磺酰脲类促胰岛素分泌药

瑞格列奈[保(乙)]

Repaglinide

【适应证】2型糖尿病。与二甲双胍合用协同作用更好。

【注意事项】服用本品可引起低血糖，与二甲双胍合用会增加发生低血糖的危险性。乙醇可加重本品导致的低血糖症状，并延长低血糖反应持续时间。

【禁忌证】(1) 已知对本药任一成分过敏者。(2) 1型糖尿病、伴或不伴昏迷的糖尿病酮症酸中毒、严重的肝肾功能不全者。(3) 妊娠及哺乳期妇女。(4) 12岁以下儿童。

【不良反应】偶见皮肤瘙痒、皮疹、荨麻疹等皮肤过敏反应；罕见低血糖、腹痛、恶心；非常罕见腹泻、呕吐和便秘、

视觉异常、肝 AST 及 ALT 升高。

【用法与用量】口服：应在主餐前 15 分钟服用，剂量因人而异。推荐起始剂量为 0.5 mg，以后如需要可每周或每 2 周作调整。接受其他口服降血糖药治疗的患者转用本品时的推荐起始剂量为 1 mg；最大的推荐剂量为 4 mg，但最大日剂量不应超过 16 mg。

【制剂与规格】瑞格列奈片：①0.5 mg；② 1 mg；③ 2 mg。

那格列奈[保(乙)]

Nateglinide

【适应证】可单独用于经饮食和运动不能有效控制高血糖的 2 型糖尿病；可与二甲双胍合用协同作用更好。不适用于对磺酰脲类降糖药治疗不理想的 2 型糖尿病患者。

【注意事项】(1) 服用本品可引起低血糖，与其他口服降糖药合用会增加发生低血糖的危险性。(2) 重度感染、手术前后或有严重外伤的患者慎用。(3) 餐前 10 分钟给药，可显著降低本品血浆峰浓度。

【禁忌证】(1) 已知对本品任一成分过敏者。(2) 1 型糖尿病、糖尿病酮症酸中毒者。(3) 儿童、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见低血糖 (2.4%)，极少见 ALT 及 AST 升高、皮肤瘙痒、皮疹、荨麻疹。

【用法与用量】口服：本品可单独应用，也可与二甲双胍合用。起始剂量一日 3 次，一次 60 mg，主餐前 15 分钟服用。常用剂量为餐前 60 ~ 120 mg，并根据 HbAlc 检测结果调整剂量。

【制剂与规格】那格列奈片：① 30 mg；② 60 mg；③ 120 mg。

5.1.2.2 非促胰岛素分泌药

5.1.2.2.1 双胍类药

二甲双胍[基(基)，保(甲/乙)]

Metformin

【适应证】首选用于单纯饮食控制及体育锻炼治疗无效的 2 型糖尿病，特别是肥胖的 2 型糖尿病患者；也可与磺酰脲类口服降血糖药合用来治疗对磺酰脲类疗效较差的糖尿病患者。

【注意事项】(1) 定期检查肾功能，可减少乳酸酸中毒的发生，尤其是老年患者，65 岁以上老人慎用。(2) 接受外科手术和碘剂 X 线摄影检查前患者需暂停口服本品。(3) 肝功能不良、既往有乳酸酸中毒史者应慎用。(4) 发热、昏迷、感染等应激状态和外科手术时，应暂停使用本品并改用胰岛素，待应激状态缓解后再恢复使用。(5) 1 型糖尿病患者不宜单独使用本品，而应与胰岛素合用。(6) 因本品可减少维生素 B_{12} 吸收，故应定期监测血象及血清维生素 B_{12} 水平。(7) 老年或营养不良患者，肾上腺或垂体功能减退、酒精中毒患者更易发生低血糖，需注意。发生时应停药。(8) 正常情况下单独用药不会产生低血糖，但与磺酰脲类和胰岛素等其他降糖药合用或饮酒时须注意出现低血糖。

【禁忌证】(1) 10 岁以下儿童、80 岁以上老人、妊娠及哺乳期妇女。(2) 肝、肾功能不全者或肌酐清除率异常者。(3) 心力衰竭、休克、急性心肌梗死及其他严重心、肺疾病。(4) 严重感染或外伤、外科大手术、低血压、缺氧等。(5) 代谢性酸中毒，糖尿病酮症酸中毒。(6) 并发严重糖尿病肾病或糖尿病眼底病变。(7) 酗酒者、维生素 B_{12} 及叶酸缺乏未纠正者。(8) 需接受血管内注射碘化造影剂检查前，应暂停用本品。(9)对本品过敏者。

【不良反应】常见腹泻、恶心、呕吐、胃胀、乏力、消化不良、腹部不适及头痛；少见大便异常、低血糖、肌痛、头晕、指甲异常、皮疹、出汗增加、味觉异常、胸部不适、寒战、流感症状、潮热、心悸、体重减轻等；罕见乳酸性酸中毒。

【用法与用量】遵医嘱，从小剂量开始逐渐增加剂量。通常口服起始剂量为 0.5 g，一日 2 次；或 0.85 g，一日 1 次；随餐服用；逐渐加至每日 2 g，分次服用。10 ~ 16 岁的 2 型糖尿病患者本品的每日最高剂量为 2 g；成人最大推荐剂量为每日 2.55 g；每日剂量超过 2 g 时，为了更好的耐受，最好随三餐分次服用。

【制剂与规格】二甲双胍片：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 0.85 g。

二甲双胍肠溶片：0.25 g。

二甲双胍马来酸罗格列酮片：每片含盐酸二甲双胍 500 mg 和马来酸罗格列酮 2 mg（以罗格列酮计）。推荐用药剂量：①二甲双胍单药治疗控制不佳的患者，一般本品的起始剂量为 4 mg 罗格列酮（每日总剂量）+ 现用的二甲双胍剂量；②罗格列酮单药治疗控制不佳的患者，一般本品的起始剂量为 1 000 mg 二甲双胍（每日总剂量）+ 现用的罗格列酮剂量；③从罗格列酮和二甲双胍联合治疗转用本品，通常本品的起始剂量为已用的罗格列酮剂量和二甲双胍剂量；④如果需要加强血糖控制，本品的每日剂量可按需要增加罗格列酮 4 mg 和（或）二甲双胍 500 mg，推荐的每日最大剂量为 8 mg/2 000 mg。

5.1.2.2.2 α－葡萄糖苷酶抑制药

阿卡波糖[保（乙）]

Acarbose

【适应证】配合饮食控制用于 2 型糖尿病；降低糖耐量低减者的餐后血糖。

【注意事项】(1) 如果服药 4 ~ 8 周后疗效不明显，可增加剂量；如因不良反应不能再增加剂量时可减少剂量。(2) 个别病人使用大剂量时可发生无症状肝 AST 及 ALT 升高，应在用药前期 6 ~ 12 个月监测肝 AST 及 ALT 变化，但停药后可恢复正常。(3) 本品可使蔗糖分解为果糖和葡萄糖的速度缓慢，因此如发生急性低血糖，不宜使用蔗糖，而应用葡萄糖纠正低血糖反应。

【禁忌证】孕妇、哺乳期妇女；有明显的消化和吸收障碍的慢性胃肠功能紊乱患者；患有由于胀气可能恶化的疾患（如 Roemheld 综合征、严重的疝气、肠梗阻和肠溃疡）者；严重肾功能不全（肌酐清除率每分钟 < 25 ml）者；18 岁以下患者；对本品过敏者。

【不良反应】常有胃肠胀气和肠鸣音，偶有腹泻和腹胀，极少见腹痛；偶有皮肤出现红斑、皮疹和荨麻疹等。一日 150 ~ 300 mg 用药时有个别人发生与临床相关的肝功能异常（超过正常高限 3 倍），多为一过性，极个别情况出现黄疸和（或）肝炎合并肝损害。

【用法与用量】于餐前即刻整片吞服或与前几口食物一起咀嚼服用，剂量需个体化。一般起始剂量为一次 50 mg，一日 3 次，以后逐渐增加至一次 100 mg，一日 3 次；或遵医嘱。

【制剂与规格】阿卡波糖片：50 mg。

阿卡波糖胶囊：① 50 mg；② 100 mg。

伏格列波糖[保（乙）]

Voglibose

【适应证】用于改善糖尿病餐后高血糖。

【注意事项】(1) 严重肝硬化患者用药时应注意观察排便情况和肝功能，发现异常立即停药及处理。(2) 单用本品或与其他降糖药合用时，可出现低血糖，一旦发生，应给予葡萄糖（单糖），而不用蔗糖等双糖类进行治疗。其他见阿卡波糖。

【禁忌证】严重酮症酸中毒、糖尿病昏迷或昏迷前患者禁用；严重感染、手术前后或严重创伤禁用；其他见阿卡波糖。

【不良反应】与其他降血糖药物合用时可出现低血糖；见胃胀、肠鸣音活跃，排气增加；偶见腹泻、腹痛、便秘、食欲缺乏、恶心、呕吐、肝转氨酶升高、贫血、高钾血症、血清淀粉酶上升、高密度脂蛋白降低；罕见急性重型肝炎、伴随 AST、ALT 升高的严重肝功能障碍或黄疸。

【用法与用量】口服，成人一次 0.2 mg，一日 3 次，餐前服用，服药后即可进餐。疗效不明显时根据临床观察可将一次量增至 0.3 mg。

【制剂与规格】伏格列波糖片：0.2 mg。

5.1.2.2.3 胰岛素增敏药

罗格列酮[保（乙）]

Rosiglitazone

【适应证】用于 2 型糖尿病。也可与磺酰脲类或双胍类合用治疗单用时血糖控制不佳者。

【注意事项】(1) 心力衰竭及心功能不全者慎用，对有心力衰竭危险者应严密监测其症状和体征；老年患者可能有轻至中度水肿及轻度贫血。(2) 单药治疗或与其他降糖药合用时可见血红蛋白和血细胞

比容下降，轻度白细胞计数减少，可能与治疗后引起血容量增加有关，也可能与剂量相关。(3) 本品可使伴有胰岛素抵抗的绝经前期和无排卵型妇女恢复排卵，随着胰岛素敏感性的改善，女性患者有妊娠的可能。(4) 罕见肝功能异常报告，治疗前及治疗中应该监测肝功能。

【禁忌证】孕妇及哺乳期妇女；Ⅲ级和Ⅳ级（HYHA）心力衰竭者；儿童和未满 18 岁的青少年；2 型糖尿病有活动性肝脏疾患的临床表现或 AST 及 ALT 升高大于正常上限 2.5 倍时；对本品过敏者。

【不良反应】可见上呼吸道感染、外伤、头痛、背痛、疲劳、鼻窦炎、腹泻、低血糖；贫血、水肿、充血性心力衰竭、肺水肿和胸腔积液；罕见肝功能异常报告，罕见血管性水肿和荨麻疹；非常罕见黄斑水肿。

【用法与用量】(1) 口服单药用药：初始剂量为一日 4 mg，单次或分两次口服，8 ~ 12 周后如空腹血糖下降不满意，剂量可加至一日 8 mg，单次或分两次服用。(2) 与二甲双胍合用治疗：初始剂量为一日 4 mg，单次或分两次口服，12 周后如空腹血糖下降不满意，剂量可加至一日 8 mg，单次或分两次口服。(3) 与磺酰脲类合用治疗：剂量为一日 2 mg 或 4 mg，单次或分两次口服。本品可空腹或进餐时服用。

【制剂与规格】罗格列酮片：① 2 mg；② 4 mg；③ 8 mg。

吡格列酮 [保（乙）]

Pioglitazone

【适应证】用于 2 型糖尿病。

【注意事项】(1) 建议治疗前、治疗后定期监测肝功能，如出现恶心、呕吐、腹部疼痛、疲乏、黑尿应立即就医；如出现黄疸则停药。(2) 服药与进食无关，定期测定空腹血糖和 HbA1c 以监测血糖对本品的反应。(3) 对于绝经期前无排卵的胰岛素抵抗病人，本品可使排卵重新开始，有可能需考虑采取避孕措施。

【禁忌证】对本品过敏者；心功能Ⅲ级或Ⅳ级（HYHA）的患者禁用；有活动性肝脏疾患的临床表现或 AST 及 ALT 升高大于正常上限 2.5 倍时，孕期和哺乳期妇女；严重肾功能障碍、感染者。

【不良反应】见罗格列酮。

【用法与用量】口服：(1) 单药治疗：初始剂量可为一次 15 mg 或 30 mg，一日 1 次，反应不佳时可加量至 45 mg，一日 1 次。(2) 与磺酰脲类合用：本品可为 15 mg 或 30 mg，一日 1 次，当开始本品治疗时，磺酰脲类药物剂量可维持不变；当患者发生低血糖时，应减少磺酰脲类药物用量。(3) 与二甲双胍合用：本品可为 15 mg 或 30 mg，一日 1 次，开始本品治疗时，二甲双胍剂量可维持不变。(4) 与胰岛素合用：本品为 15 mg 或 30 mg，一日 1 次，开始本品治疗时，胰岛素用量可维持不变，出现低血糖时可降低胰岛素量。最大推荐量不应超过一日 45 mg，一日 1 次；联合用药勿超过 30 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】吡格列酮片：15 mg。

吡格列酮口腔崩解片：15 mg。

盐酸吡格列酮片：30 mg。

5.1.2.2.4 醛糖还原酶抑制药

依帕司他 [保（乙）]

Epalrestat

【适应证】用于糖尿病神经病变。

【注意事项】(1) 老年患者适当减量，妊娠及哺乳期妇女权衡利弊再用，儿童慎用。(2) 糖尿病患者、肾脏损害患者、肝脏疾病患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见：(1) 过敏：红斑、水疱、皮疹、瘙痒。(2) 肝脏：胆红素、AST、ALT 及 γ-GTP 升高。(3) 消化系统：腹泻、恶心、呕吐、腹痛、食欲减退、腹胀、胃部不适。

【用法与用量】口服：成人常用剂量一次 50 mg，一日 3 次，餐前服用。老年患者如有生理功能的改变，使用本品时应考虑适当减量。

【制剂与规格】依帕司他片：50 mg。

5.2 甲状腺疾病及其药物治疗

5.2.1 甲状腺功能亢进症及其治疗药物

血循环中的甲状腺激素过多而引起的

以神经、循环、消化等系统兴奋性增高和代谢亢进为主要表现的一组临床综合征称为甲状腺毒症（thyrotoxicosis）；由于甲状腺腺体本身功能亢进，合成和分泌甲状腺激素增加所导致的甲状腺毒症称为甲状腺功能亢进症（hyperthyroidism），简称甲亢。

临床表现主要因循环中甲状腺激素过多引起，其症状和体征的严重程度与病史长短、甲状腺激素升高程度和病人年龄等因素相关。少数老年患者高代谢症状不典型，而仅表现为乏力、心悸、厌食、抑郁、嗜睡、体重明显减少，称为“淡漠型甲状腺功能亢进”（apathetic hyperthyroidism）。

甲状腺功能亢进症的治疗主要采用以下3种方式：①抗甲状腺药物（antithyroid drugs，ATD）；② ^{131}碘治疗；③甲状腺功能亢进控制后行甲状腺次全切除手术。抗甲状腺素药物包括丙硫氧嘧啶、甲巯咪唑、碘剂及其他药物等。

丙硫氧嘧啶[基（基），保（甲）]

Propylthiouracil

【适应证】(1) 甲状腺功能亢进症的内科治疗：适用于病情轻，甲状腺轻、中度肿大的甲状腺功能亢进患者；年龄＜20岁、妊娠期甲状腺功能亢进、年老体弱或合并严重心、肝、肾疾病不能耐受手术者，不适宜手术或放射性碘治疗者、手术后复发而不适于放射性碘治疗者均宜采用药物治疗，也可作为放射性碘治疗时的辅助治疗。(2) 甲状腺危象的治疗：作为辅助治疗以阻断甲状腺素的合成。(3) 术前准备：为了减少麻醉和术后并发症，防止术后发生甲状腺危象。

【注意事项】(1) 本品可透过胎盘屏障，并引起胎儿甲状腺功能减退及甲状腺肿大，甚至在分娩时造成难产、窒息，因此对患甲状腺功能亢进的孕妇宜采用最小有效剂量的抗甲状腺药物。本品可由乳汁分泌，可能引起婴儿甲状腺功能减退，故不宜哺乳。(2) 小儿用药应根据病情调节用量，老年人尤其肾功能减退者，用药量应减少。甲状腺功能亢进控制后及时减量，用药过程中应加用甲状腺素，避免出现甲状腺功能减退。(3) 外周血白细胞数降低，如出现粒细胞缺乏，中性粒细胞计数少于 1.5×10^9/L 应立即停药；老年患者发生血液不良反应的危险性增加。(4) 对硫脲类药物过敏者慎用。(5) 如出现肝炎的症状和体征，应停止用药。

【禁忌证】严重肝肾功能损害、严重粒细胞缺乏、对本品及其他硫脲类药过敏者。

【不良反应】多发生在用药初始的2个月。一般不良反应为胃肠道反应、关节痛、头痛、皮肤瘙痒、皮疹、药物热等；血液不良反应为轻度粒细胞减少，少见为严重粒细胞缺乏、血小板减少、脉管炎和红斑狼疮样综合征；罕见间质性肺炎、肾炎、黄疸、肝功能损害、免疫功能紊乱等。

【用法与用量】口服，用药剂量应个体化，根据病情、治疗反应及甲状腺功能检查结果随时调整。一日剂量分次口服，间隔时间尽可能平均。(1) 成人甲状腺功能亢进：开始剂量一般为一次100 mg，一日3次，一日最大量为600 mg。通常发挥作用多在4周以后。当症状消失，血中甲状腺激素水平接近正常后逐渐减量。每2～4周减药1次，减至最低有效剂量一日50～100 mg时维持治疗，总疗程一般为1.5～2年。治疗过程中出现甲状腺功能减退或甲状腺明显增大时可酌情加用左甲状腺素或甲状腺片。(2) 儿童甲状腺功能亢进：开始剂量为一日按体重4 mg/kg，分次口服，维持量酌减。(3) 甲状腺危象：一日400～800 mg，分3～4次服用，疗程不超过1周，作为综合治疗措施之一。(4) 甲状腺功能亢进术前准备：一次100 mg，一日3～4次，使甲状腺功能恢复到正常或接近正常，然后加服2周碘剂再进行手术。

【制剂与规格】丙硫氧嘧啶片：①50 mg；②100 mg。

甲巯咪唑[基（基），保（甲）]

Thiamazole

【适应证】【注意事项】同丙硫氧嘧啶。

【禁忌证】对本品过敏者、哺乳期妇女。

【不良反应】常见皮肤瘙痒、皮疹、白细胞计数减少；少见严重粒细胞缺乏、血小板减少、凝血因子Ⅱ和Ⅶ降低，可见

味觉减退、恶心、呕吐、上腹不适等胃肠道反应、关节痛、脉管炎、红斑狼疮样综合征、肝功能损害等。

【用法与用量】口服：(1) 成人甲状腺功能亢进：开始一日 30 mg，可按病情轻重调节为一日 15 ~ 45 mg，一日最大量 60 mg，一般均分 3 次口服，但也可一日单次顿服。病情控制后，逐渐减量，维持量为一日 5 ~ 15 mg，疗程一般 1 ~ 1.5 年。(2) 儿童甲状腺功能亢进：开始时剂量为一日按 0.4 mg/kg 体重，最大剂量为 30 mg，分次口服。维持量约减半或按病情轻重调节。

【制剂与规格】甲巯咪唑片：① 5 mg；② 10 mg。

卡比马唑[保(乙)]

Carbimazole

【适应证】适用于各种类型的甲状腺功能亢进症，尤其适用于：①病情较轻，甲状腺轻至中度肿大患者；②青少年、儿童及老年患者；③甲状腺手术后复发，又不适于用放射性 ^{131}I 治疗者；④手术前准备；⑤作为 ^{131}I 放疗的辅助治疗。

【注意事项】(1) 服药期间宜定期检查血象。(2) 孕妇、肝功能异常、外周血白细胞数偏低者应慎用。(3) 对诊断的干扰：甲巯咪唑可使凝血酶原时间延长，并使血清碱性磷酸酶、AST 及 ALT 增高，还可能引起血胆红素及血乳酸脱氢酶升高。

【禁忌证】对本品成分或甲巯咪唑过敏者哺乳期妇女禁用。

【不良反应】较多见皮疹或皮肤瘙痒及白细胞减少；较少见严重的粒细胞缺乏症；可能出现再生障碍性贫血；还可能致味觉减退、恶心、呕吐、上腹部不适、关节痛、头晕头痛、脉管炎、红斑狼疮样综合征。罕致肝炎、间质性肺炎、肾炎和累及肾脏的血管炎，少见致血小板减少、凝血酶原减少或因子Ⅶ减少。

【用法与用量】(1) 成人，开始剂量一般为一日 30 mg，可按病情轻重调节为 15 ~ 40 mg，一日最大量 60 mg，分次口服；病情控制后，逐渐减量，维持量按病情需要一日 5 ~ 15 mg，疗程一般 18 ~ 24 个月。(2) 小儿，开始时用量为一日 0.4 mg/kg，分次口服，维持量按病情决定。

【制剂与规格】卡比马唑片：5 mg。

碘和碘化物

Iodine and Iodides

【适应证】用于甲状腺次全切除的准备；甲状腺危象；严重甲状腺毒症心脏病。

【注意事项】(1) 行甲状腺次全手术切除准备：患者需先服一段时间抗甲状腺素药物，使症状基本控制，甲状腺功能正常，减药后于手术前两周再加用碘制剂。(2) 治疗甲状腺危象：必须同时配合应用硫脲类药物。(3) 本品可影响甲状腺功能值的测定及核素甲状腺扫描的结果。(4) 大量饮水和增加食盐的摄入可加快碘的排泄。(5) 长期应用可出现口内铜腥味、喉部烧灼感、鼻炎、皮疹等，停药即可消退。(6) 碘主要由肾脏排泄，肾功能受损者慎用。

【禁忌证】对碘有过敏史者；妊娠及哺乳期妇女、婴幼儿。

【不良反应】少数对碘过敏患者，在用药后立即或几小时后发生血管神经性水肿、上呼吸道黏膜刺激症状，甚至喉头水肿引起窒息。

【用法与用量】口服：(1) 治疗甲状腺危象：在有效应用抗甲状腺药物（首选丙硫氧嘧啶）1 ~ 2 小时后使用碘制剂，复方碘溶液（Lugol 液）一次 5 滴，6 小时 1 次，或碘化钠 1 g 溶于 500 ml 常用输液中避光静脉滴注 12 ~ 24 小时，一般使用 3 ~ 7 日停药。(2) 甲状腺功能亢进症手术前准备：于术前 2 周服复方碘口服溶液，一日 3 次，一次从 5 滴逐日增加至 15 滴。

【制剂与规格】复方碘溶液：100 ml，含碘 5 g、碘化钾 10 g。

放射性 ^{131}碘

^{131}I

【适应证】25 岁以上、Graves 甲状腺功能亢进伴甲状腺肿大Ⅱ度以上；ATD 治疗失败或过敏；甲状腺功能亢进手术后复发；甲状腺功能亢进性心脏病或甲状腺

功能亢进伴其他病因的心脏病；甲状腺功能亢进合并白细胞和（或）血小板减少或全血细胞减少；老年甲状腺功能亢进；甲状腺功能亢进合并糖尿病；毒性多结节性甲状腺肿；自主功能性甲状腺结节合并甲状腺功能亢进。

相对适应证为：青少年和儿童甲状腺功能亢进，用抗甲状腺药物治疗失败、拒绝手术或有手术禁忌证；甲状腺功能亢进合并肝功能损害；浸润性突眼，对轻度和稳定期的浸润性突眼可单用 ^{131}I 治疗甲状腺功能亢进，对进展期患者，可在 ^{131}I 治疗前后加用泼尼松。

【注意事项】应用本品有发生甲状腺功能减退的风险，在发生甲状腺功能减退后，可用 L-T_4 补充或替代治疗使患者的甲状腺功能维持正常。由于甲状腺功能减退并发症的发生率较高，在用 ^{131}I 治疗前需要患者知情并签字同意。因 ^{131} 碘有放射性，患者应在核医学科进行治疗。

【禁忌证】妊娠期和哺乳期妇女；重度浸润性突眼；严重心脏、肝肾衰竭、活动性肺结核患者；对本品过敏者。

【用法与用量】口服，^{131}I 剂量根据甲状腺大小及患者病情行个体化治疗。

其他治疗药物还包括如下几类。

碳酸锂[保(甲/乙)] 可抑制甲状腺激素分泌，主要用于对于抗甲状腺素药物和碘剂都过敏的患者，控制甲状腺毒症，剂量一次 300 ~ 500 mg，8 小时 1 次。（其他见 1.15）

地塞米松[基(基)，保(甲/乙)] 口服一次 2 mg，6 小时 1 次，可以抑制甲状腺激素分泌和外周组织 T_4 转换为 T_3。丙硫氧嘧啶、碘制剂和地塞米松同时给予治疗严重的甲状腺毒症患者，可以使其血清 T_4 水平在 24 ~ 48 小时恢复正常。（其他见 5.4.4.2）

β 肾上腺素受体拮抗药，作为甲状腺功能亢进治疗的辅助药物，其作用：①从受体部位阻滞儿茶酚胺的作用，减轻甲状腺毒症的症状；②具有抑制外周组织 T_4 转换为 T_3 的作用；③通过独立的非肾上腺能受体途径拮抗甲状腺激素对心肌的直接作用；④对严重心动过速导致的心功能不全有效。目前治疗甲状腺功能亢进使用最广泛的 β 受体拮抗药是普萘洛尔，一般甲状腺功能亢进患者一次 10 ~ 20 mg，一日 3 次，甲状腺功能亢进危象患者一次 20 ~ 80 mg，4 ~ 6 小时 1 次。禁忌证为：支气管哮喘、慢性阻塞性肺病、妊娠期甲状腺功能亢进妇女、心脏传导阻滞、充血性心力衰竭，对本品过敏者。甲状腺功能亢进合并心功能不全者慎用，需在心血管医师指导下使用。

5.2.2 甲状腺功能减退症及其药物治疗

甲状腺功能减退症(hypothyroidism，简称甲减)，是由于甲状腺激素合成和分泌减少或组织利用不足导致的全身代谢减低综合征。根据甲状腺功能减低的程度可分为临床甲状腺功能减退（overt hypothyroidism）和亚临床甲状腺功能减退（subclinical hypothyroidism）两类。临床表现以代谢率减低和交感神经兴奋性下降为主，病情轻的早期病人可以没有特异症状。

甲状腺功能减退症的治疗主要是甲状腺激素的补充或替代治疗，多数患者为终身替代。常用药物有甲状腺片、左甲状腺素钠、碘塞罗宁等。

甲状腺片[基(基)，保(甲)]

Thyroid Tablets

【适应证】用于各种原因引起的甲状腺功能减退症。

【注意事项】(1) 长期过量可引起甲状腺功能亢进症的临床表现，如心悸、手震颤、多汗、体重减轻、神经兴奋性升高和失眠；在老年和心脏病患者可发生心绞痛和心肌梗死。可用 β 受体拮抗药治疗，并立即停用本品。(2) 因甲状腺激素只有极少量可透过胎盘，由乳汁排泌亦甚微，故孕妇或哺乳期妇女服用适量甲状腺素对胎儿或婴儿无不良影响。(3) 老年患者对甲状腺激素较敏感，超过 60 岁者甲状腺激素替代需要量比年轻人约低 25%。(4) 避免与其他药物合用，因可能干扰甲

状腺激素的作用。(5) 对伴有心血管病的甲状腺功能减退患者，要注意出现心肌缺血或心律失常的可能，防止用药过快或过量。(6) 下列情况慎用：①心血管疾病，包括心绞痛、动脉硬化、冠心病、高血压、心肌梗死、心功能不全者等；②病程长、病情重的甲状腺功能减退或黏液性水肿患者应谨慎治疗，开始用小剂量，以后缓慢增加直至生理替代剂量；③伴有腺垂体功能减退或肾上腺皮质功能不全患者应先用肾上腺皮质类固醇药物，待肾上腺皮质功能恢复正常后再用本类药。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】过量可出现甲状腺功能亢进症状。

【用法与用量】用药应高度个体化，正确掌握剂量，每日按时服药。成人常用量：口服，开始为一日 10 ~ 20 mg，逐渐增加，维持量一般为一日 40 ~ 80 mg。由于本品 T_3 和 T_4 的含量和两者的比例不恒定，在治疗中应根据临床症状及实验室检查调整剂量。

【制剂与规格】甲状腺片：40 mg。

碘塞罗宁 [保(乙)]

Liothyronine

【适应证】用于治疗需要迅速见效的甲状腺功能减退症患者；甲状腺功能亢进症的辅助诊断。

【注意事项】在甲状腺功能正常时，三碘甲腺原氨酸在血中的半衰期约为1日；在甲状腺功能减退时，略延长；在甲状腺功能亢进时约为 0.6 日。T_3 作用快，用药后数小时即发挥效应，24 ~ 72 小时作用达高峰，停药后作用持续 24 ~ 72 小时，故主要用于治疗需要迅速见效的甲状腺功能减退病人，而一般替代治疗中，应首选甲状腺素 (T_4)。对于年龄大、心功能不全或严重长期甲状腺功能减退患者，开始治疗剂量要小，增加剂量幅度应小，加量速度要慢。

【不良反应】同甲状腺片。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】(1) 口服：①甲状腺功能减退症的治疗：成人开始时一日 10 ~ 20 μg，分 2 ~ 3 次口服，每 1 ~ 2 周递增 15 ~ 20 μg，直至甲状腺功能恢复正常，维持量一日 25 ~ 50 μg。儿童体重在 7 kg 以下者开始时一日 2.5 μg，7 kg 以上一日 5 μg。以后每隔 1 周增加用量，直至甲状腺功能恢复正常，维持量为一日 15 ~ 20 μg，分 2 ~ 3 次口服。②三碘甲腺原氨酸 (T_3) 抑制试验：用于对摄碘率高的患者做鉴别诊断。摄碘率高的患者一日口服 80 μg，分 3 次服用，连服 7 ~ 8 日，服药前后做 ^{131}I 摄碘试验，正常人及单纯性甲状腺肿患者摄碘率受抑制数超过服本品前之基数的 50% 以上，而甲状腺功能亢进症患者受抑制的数值低于 50%。(2) 静脉注射：对黏液性水肿昏迷患者，首次剂量 40 ~ 120 μg，以后每 6 小时 5 ~ 15 μg，直到患者清醒后再改为口服。

【制剂与规格】碘塞罗宁钠片：20 μg。

注射用碘塞罗宁钠：20 μg。

左甲状腺素(左旋甲状腺素) [保(乙)]

Levothyroxine

【适应证】各种病因所致的甲状腺功能减退症。

【注意事项】本品可从胃肠道吸收，但吸收不完全，吸收率不规则，特别是在与食物同服时，因此最好在空腹时服用。T_4 吸收入血后，绝大部分与血浆蛋白结合。甲状腺功能正常时，T_4 在血中的半衰期 6 ~ 7 日，甲状腺功能减退时 9 ~ 10 日，甲状腺功能亢进时 3 ~ 4 日。由于半衰期长，口服后 1 ~ 2 周才能达到最高疗效，停药后作用可持续 1 ~ 3 周。甲状腺激素不易透过胎盘，因此甲状腺功能减退患者在妊娠时无须停药，微量的甲状腺激素可从乳汁中排出。剂量应个体化，根据甲状腺功能测定结果及患者的临床情况确定。

【禁忌证】【不良反应】同甲状腺片。

【用法与用量】(1) 口服：可于早餐前 0.5 小时，空腹一次性给予一日剂量。成人患者左甲状腺素 ($L-T_4$) 补充或完全替代剂量为一日 50 ~ 150 μg，开始剂量一日 25 ~ 50 μg，每 2 ~ 4 周增加 25 ~ 50 μg。按照体重计算的剂量是一日 1.6 ~ 1.8 μg/kg；儿童需要较高的剂量，约一日 2.0 μg/kg；一日完全替代剂量为：6 个月以内 6 ~ 8 μg/kg；6 ~ 12 个月

6 μg/kg；1 ~ 5 岁 5 μg/kg；6 ~ 12 岁 4 μg/kg。开始时应用完全替代量的 1/3 ~ 1/2，以后每 2 周逐渐增量。老年患者则需要较低的剂量，约一日 1.0 μg/kg；开始剂量为一日 12.5 ~ 25 μg，以后每 4 ~ 8 周递增 25 μg，一般一日 75 ~ 100 μg 即可。妊娠时的替代剂量需要增加 30% ~ 50%；甲状腺癌术后的患者需要大剂量替代，约一日 2.2 μg/kg，控制 TSH 在防止肿瘤复发需要的水平。(2) 静脉注射：适用于黏液性水肿昏迷，首次剂量宜较大，一日 200 ~ 400 μg，以后一日 50 ~ 100 μg，直到病人清醒改为口服给药。

【制剂与规格】左甲状腺素片：① 25 μg；② 50 μg；③ 100 μg。

左甲状腺素注射剂：① 1 ml：100 μg；② 2 ml：200 μg；③ 5 ml：500 μg。

5.3 垂体疾病及其药物治疗

5.3.1 肢端肥大症及其治疗药物

肢端肥大症（acromegaly）是垂体生长激素（GH）异常分泌增多而导致的一种罕见疾病，多为垂体 GH 分泌细胞腺瘤所致，有的腺瘤中除含生长激素细胞外，也可含有促催乳素细胞，称为混合性细胞腺瘤，少数为增生或癌。如果 GH 的过度分泌发生在青春期之前，则出现巨人症（gigantism）；若发生在青春期之后，则使体内有软骨的部位如手指（趾）、下颌、眼眶、鼻骨等处继续增生，使病人出现鼻大、唇厚、舌肥厚、头围及手足增大，皮肤增厚，颜面粗糙的肢端肥大症典型体征。

治疗根据肿瘤大小决定经颅或经蝶窦行显微外科手术切除垂体肿瘤；不能手术者则一般采用放射治疗，治疗后如有垂体功能减退等并发症时给予相应的激素补充或替代治疗；如有复发可用生长素释放抑制激素类似物（如奥曲肽）或溴隐亭治疗，使 GH 分泌正常。

奥曲肽[保（乙）]

Octreotide

【适应证】用于治疗活动性肢端肥大症。

【注意事项】(1) 对长期接受同一剂量治疗的病人每 6 个月测定一次生长激素浓度。应定期随诊蝶鞍区磁共振检查，如发现垂体肿瘤增大，尤其出现视交叉压迫等，及时转换治疗。(2) 定期胆囊 B 超声检查及胆囊脂餐试验，及早预防和处理胆囊沉积物。(3) 对有糖尿病尤其在用胰岛素治疗者、胰岛素瘤患者，可能发生低血糖，注意调整胰岛素用量。(4) 注射前让药液达到室温，避免短期内在同一部位注射，减轻注射后的局部反应。在两餐间或睡觉前用药，可减轻胃肠道不良反应的发生。(5) 肾功能异常、胰腺功能异常、胆石症、胰岛素瘤、老年人、高尿酸血症、全身感染者应慎用。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女、儿童；对本品过敏者。

【不良反应】(1) 局部反应：如注射部位疼痛、局部红肿、烧灼感；(2) 胃肠道反应：如腹胀、腹痛、腹泻、食欲减退、恶心、呕吐，个别患者出现严重水泻，类似急性肠梗阻样腹痛、腹胀、腹肌紧张等；(3) 诱发胆囊结石、胰腺炎；(4) 血糖调节紊乱，偶见持续高血糖、糖耐量减退、低血糖；(5) 少数患者肝功能异常，包括胆汁淤积性肝炎。

【用法与用量】(1) 皮下注射：开始 8 小时皮下注射一次，一次 50 ~ 100 μg，然后每月根据血清生长激素和血清胰岛素样生长因子(IGF-1)水平和临床反应调整。多数患者一日最适剂量为 200 ~ 300 μg，一日最大剂量不得超过 1 500 μg。用药 1 个月后血清生长激素水平不下降和无临床反应时应考虑停药。生长激素下降到正常水平后可减少剂量，以最小有效剂量维持；在起效后可改用长效奥曲肽维持治疗。(2) 肌内注射：用长效奥曲肽，起始剂量 20 mg，深部肌内注射，4 周 1 次，生长激素水平下降不够满意时，第 4 针后改为一次 30 mg，若血清生长激素水平或（及）IGF-1 水平下降 <50%，停药改用其他治疗。

【制剂与规格】奥曲肽注射剂：① 1ml：50 μg；② 1ml：100 μg。

注射用长效奥曲肽：① 20 mg；② 30 mg。

5.3.2 侏儒症的治疗药物

重组人生长激素[保(乙)]

Recombinant Human Growth Hormone

【适应证】用于因内源性生长激素缺乏所引起的儿童生长缓慢；用于重度烧伤治疗；用于已明确的下丘脑－垂体疾病所致的生长激素缺乏症和经两种不同的生长激素刺激试验确诊的生长激素显著缺乏。

【注意事项】在医生指导下用于明确诊断的患者。糖尿病患者可能需要调整抗糖尿病药物的剂量。同时使用皮质激素会抑制生长激素的促生长作用，因此患ACTH缺乏的患者应适当调整其皮质激素的用量，以避免其对生长激素产生的抑制作用。少数病人在生长激素治疗过程中可能发生甲状腺功能低下，应及时纠正，以避免影响生长激素的疗效，因此病人应定期进行甲状腺功能的检查，必要时给予甲状腺素的补充。患内分泌疾患（包括生长激素缺乏症）的病人可能发生股骨头骺板滑脱，在生长激素的治疗期若出现跛行现象应注意评估。有时生长激素可导致过度胰岛素状态，因此必须注意病人是否有葡萄糖耐量减低的现象。治疗期间血糖高于10 mmol/L，则须胰岛素治疗。如一日使用150 U以上胰岛素仍不能有效控制血糖，则应停用本品。应常变动注射部位以防脂肪萎缩。孕妇及哺乳期妇女不宜使用。老年人使用尚无系统临床研究。

【禁忌证】骨骺已完全闭合后禁用于促生长治疗；严重全身性感染等危重病人在机体急性休克期内禁用。

【不良反应】生长激素可引起一过性高血糖现象，通常随用药时间延长或停药后恢复正常。临床试验中有1%的身材矮小儿童有不良反应，常见注射部位局部一过性反应（疼痛、发麻、红肿等）和体液潴留的症状（外周水肿、关节痛或肌痛），这些不良反应发生较早，发生率随用药时间延长而降低，罕见影响日常活动。长期注射重组人生长激素在少数患者体内引起抗体产生，抗体结合力低，无确切临床意义，但如果预期的生长效果未能达到，则可能有抗体产生，抗体结合力超过2 mg/L，则可能会影响疗效。

【用法与用量】(1) 用于促儿童生长的剂量因人而异，推荐剂量为一日0.1～0.15 U/kg，一日1次，皮下注射，疗程为3个月至3年，或遵医嘱。(2) 用于重度烧伤治疗推荐剂量为一日0.2～0.4 U/kg，一日1次，皮下注射。疗程一般为2周左右。(3) 用于成人替代疗法的剂量必须因人调整。通常推荐从低剂量开始，如一日0.5 U（0.17 mg）或最大一日0.02 U/kg，相当于一日0.007 mg/kg；经过1、2个月的治疗，可将剂量逐步调整至一日0.04 U/kg，相当于一日0.013 mg/kg。血清中胰岛素样生长因子Ⅰ（IGF-Ⅰ）的水平可作为剂量参考。随年龄增长剂量降低。

【制剂与规格】注射用重组人生长激素：① 1 ml：2.5 U（0.85 mg)；② 1 ml：4.0 U（1.33 mg）；③ 1 ml：4.5 U（1.7 mg)；④ 1 ml：10 U（3.7 mg)。

5.3.3 高催乳素血症及其治疗药物

正常催乳素（PRL）呈脉冲性释放，并具有昼夜节律，对乳腺发育、泌乳和卵巢功能起重要调节作用。高催乳素血症（Hyperprolactinemia，HPRL）系指由内、外环境因素引起以PRL升高、闭经、溢乳、无排卵和不孕为特征的综合征。病理性高催乳素血症由下丘脑－垂体的良性肿瘤，如催乳素腺瘤、生长激素瘤等引起。治疗可以手术后辅以药物或放疗，也可以药物为主治疗。药物以溴隐亭效果为最佳。

甲磺酸溴隐亭[保(乙)]

Bromocriptine Mesylate

【适应证】(1) 月经周期紊乱及女性不孕症如催乳素依赖性闭经、月经过少、黄体功能不足、药物诱导的高催乳素血症。(2) 垂体乳素瘤及其所致的女性闭经和（或）溢乳、男性性功能减退，为垂体催乳素微腺瘤及大腺瘤（包括有视力障碍者）的首选治疗，也可作为大腺瘤手术前用药及因无法手术而行放疗的大腺瘤的辅助用药。(3) 因高催乳素血症引起男性性功能减退及合并有高催乳素血症的男性不

育症。(4) 各期原发性或脑炎后帕金森病的单独治疗或与抗帕金森药联合治疗。(5) 肢端肥大症。

【注意事项】(1) 对麦角生物碱过敏者对本品也可能过敏。(2) 用药后如出现肝功能损害，应酌减剂量。(3) 溴隐亭治疗可能会恢复生育能力。不愿生育的育龄妇女，服用溴隐亭期间须使用可靠的避孕措施。(4) 一旦出现血管痉挛或血栓形成的症状，持续头痛或其他中枢神经系统毒性表现，治疗应立即终止。(5) 一旦出现胃肠道出血和胃溃疡应终止治疗。对于有活动性溃疡病或溃疡病史的患者，接受溴隐亭治疗过程中，应严密监测。(6) 偶见在治疗头几日会出现低血压，并可能使精神警觉性下降。因此在驾驶或操作机器时应特别谨慎。(7) 分娩后和产褥期使用，少数分娩后妇女接受溴隐亭抑制泌乳治疗时出现高血压、心肌梗死、癫痫、卒中及精神障碍等严重反应，其中一些患者在严重头痛或短暂视觉障碍后发生癫痫或卒中。一旦出现高血压，严重的、持续的或逐渐加重的头痛（伴或不伴视觉障碍）或中枢神经系统毒性表现，治疗应立即终止，并即刻对患者病情进行判定。对近期或正在服用可影响血压的药物（如血管收缩药或麦角碱类）的患者使用溴隐亭时应谨慎，不推荐分娩后和产褥期的妇女联合使用。(8) 垂体大腺瘤患者，应严密观察肿瘤大小，如肿瘤进展，应首先考虑外科治疗。(9) 如治疗期间妊娠，应立即停药，密切观察。在妊娠期间，泌乳素分泌性腺瘤可能会增长，必要时行外科手术。(10) 泌乳素大腺瘤可并发视野缺损。对于泌乳素大腺瘤患者，在治疗中应监测视野变化，以便及早发现上述情况并予以调整药物剂量。(11) 15 岁以下儿童应限制使用。(12) 用药期间从事驾驶或高空作业应特别小心。(13) 应在睡前、进食时或餐后服用，以减少胃肠道不良反应。

【禁忌证】严重心脏疾病、周围血管性疾病、严重精神病、肢端肥大伴有溃疡病或出血史、自发及家族性震颤、未经治疗的高血压、妊娠毒血症者、对本药过敏者。妊娠和哺乳期妇女。

【不良反应】多发生于治疗开始阶段，常见症状性、直立性低血压、恶心；大剂量用药后出现精神障碍、异动症（如面、舌、臂、手、头及身体下部的不自主运动）、幻觉、腹痛、胃肠胀气、水样便、软便；呼吸道感染、头痛、月经失调、焦虑、疲劳、泌尿道感染、瘙痒、皮疹、荨麻疹、血管神经性水肿、过敏反应。

【用法与用量】口服：(1) 用于垂体催乳素瘤及高催乳素血症：起始剂量一次 1.25 mg，一日 2 ~ 3 次，数周后剂量可逐渐调整至一日 10 ~ 15 mg，分数次服用。维持剂量为一次 2.5 ~ 5 mg，一日 2 ~ 3 次。一日不宜超过 20 mg。(2) 肢端肥大症的辅助治疗：起始剂量一次 1.25 ~ 2.5 mg，一日 1 次，于睡前或进食时服用，逐渐增至一日 20 mg，维持剂量为一日 10 ~ 20 mg，分数次服用。(3) 用于帕金森病：起始剂量一次 0.625 ~ 1.25 mg，一日 1 ~ 2 次，若用单剂量，可于睡前或进食时服用。以后每隔 14 ~ 28 日增加剂量 2.5 mg。

【制剂】甲磺酸溴隐亭片：2.5 mg。

5.3.4 尿崩症及其治疗药物

尿崩症（diabetes insipindus）是因血管加压素（又称抗利尿激素）分泌不足所致，又称中枢性或垂体性尿崩症；或因肾脏对血管加压素反应缺陷而引起的一组症候群（又称肾性尿崩症），其临床特点是多尿、烦渴、低比重尿和低渗尿。

中枢性尿崩症的治疗主要采用血管加压素替代疗法，但治疗剂量应个体化且从小剂量开始，以避免治疗过度。其他治疗药物可选用氢氯噻嗪、氯磺丙脲、卡马西平等。

加压素

Vasopressin

【适应证】用于中枢性尿崩症。

【注意事项】(1) 癫痫、偏头痛、哮喘患者慎用。(2) 用药后如出现面色苍白、出汗、心悸、胸闷、腹痛、过敏性休克等，应立即停药。(3) 注射局部如有严重炎症反应时，应注意更换注射部位。(4) 加压素水剂注射液一般不作为长期治疗用药，可在手术、外伤、昏迷时短期或临时使用。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠期及

哺乳期妇女、动脉硬化、心力衰竭、冠心病、高血压患者、肾功能不全氮质血症期。

【不良反应】大剂量可出现恶心、皮疹、腹泻、盗汗、女性子宫收缩；重者可有支气管痉挛、休克、心肌缺血、室性心律失常、心肌梗死；注射局部皮肤坏疽、血栓及局部刺激等。

【用法与用量】成人：皮下或肌内注射，一次 3 mg，一日 2 ~ 3 次。儿童：皮下或肌内注射，一次 1 ~ 1.5 mg，一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】加压素注射液：① 1 ml∶6 mg；② 1 ml∶12 mg。

鞣酸加压素注射液：5 ml∶100 mg。

醋酸去氨加压素[保(甲/乙)]

Desmopressin Acetate

【适应证】用于中枢性尿崩症；也可用于治疗 6 岁以上患者儿童的夜间遗尿症。

【注意事项】(1) 急迫性尿失禁患者；器官病变导致的尿频和多尿不适合用本品治疗。(2) 治疗夜遗尿时，应在服药前 1 小时和服药后 8 小时限制饮水，否则易出现水潴留和（或）低钠血症及其并发症（头痛、恶心、呕吐和体重增加，更严重者可引起抽搐），到时应终止治疗直到患者完全康复。(3) 老年人、血钠低和 24 小时尿量多（>2.8 ~ 3.0 L）者发生低钠血症危险性较高。(4) 与已知可导致抗利尿激素分泌异常综合征的药物、非甾体抗炎药合用时应严格控制饮水并监测血钠水平。(5) 治疗期间，出现体液和（或）电解质失衡急性并发症（如全身感染、发热和肠胃炎）时应立即停用。(6) 妊娠期妇女慎用；慎用于年幼患者。因出现低钠血症的可能性较高故不建议 65 岁以上老人使用。

【禁忌证】习惯性或精神性烦渴症者（尿量 24 小时超过 40 ml/kg）、心功能不全或其他疾病需服用利尿药者、中重度肾功能不全患者（肌酐清除率低于每分钟 50 ml）、抗利尿激素分泌异常综合征（SIADH）、低钠血症、对本品过敏者、哺乳妇女。急迫性尿失禁者、糖尿病、器官病变导致的尿频和多尿者不宜使用。

【不良反应】常见头痛、腹痛、恶心、低钠血症；罕见皮肤过敏、情绪障碍；个别有全身过敏。用药后若不限制饮水可能会引起水潴留、低钠血症，头痛、呕吐、体重增加、严重者可引起抽搐。

【用法与用量】剂量因人而异。治疗中枢性尿崩症：口服，一般成人和儿童初始一次 0.05 ~ 0.1 mg，一日 1 ~ 3 次，再根据临床疗效调整。多数成人患者的适宜剂量为一次 0.1 ~ 0.2mg，一日 2 ~ 3 次。治疗夜间遗尿症：口服，初始剂量为睡前服 0.2 mg，如疗效不显著可增至 0.4 mg，连续使用 3 个月后停用至少 1 周，以便评估是否需要继续治疗。治疗期间需限制饮水，鼻腔给药，有效剂量在 10 ~ 40 μg，从 20 μg 开始，睡前给药，治疗期间限制饮水并注意观察。

【制剂与规格】醋酸去氨加压素片：① 100 μg；② 200 μg。

醋酸去氨加压素鼻喷剂：1 m∶100 μg（每支 2.54 ml）。

醋酸去氨加压素滴鼻剂：1 m∶100 μg（每支 2.5 ml）。

5.3.5 腺垂体功能减退症及其治疗药物

腺垂体功能减退症或原发于本身病变（肿瘤、缺血、坏死、梗死、损伤和炎症、变性）约占 80%，或继发于中枢神经系统（CNS）和下丘脑病变，占 20%。临床最常见的是产后出血、休克和 DIC 所引起的垂体缺血、坏死所致腺垂体功能减退，称为希恩综合征。

腺垂体功能减退的临床表现变异性很大，可为单一的激素（常见的为促性腺激素和催乳素）或两种和多种垂体激素的功能缺陷。

腺垂体功能减退症的治疗药物主要根据所缺乏激素的种类及程度进行补充或替代治疗，应使用生理剂量，但如出现应激、感染、外伤或手术时，须视病情酌情增加剂量。

肾上腺糖皮质激素，口服泼尼松一日 5 ~ 10 mg 或氢化可的松一日 20 ~ 30 mg。

甲状腺激素，口服甲状腺素一日 50 ~ 200 μg。

性激素，女性见妇科相关激素治疗部分。

腺垂体功能减退危象时，可选用氢化

可的松琥珀酸钠，一次 100 mg（按氢化可的松计算）以 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液稀释后静脉滴注。可用至一日 300 mg，疗程不超过 3 ~ 5 日，以后逐渐减量。

5.4　肾上腺疾病及其药物治疗以及肾上腺皮质激素类药物

5.4.1　嗜铬细胞瘤及其治疗药物

嗜铬细胞瘤（pheochromocytoma）是由神经嵴起源的嗜铬细胞产生的肿瘤，可合成、储存并释放大量儿茶酚胺，产生临床症状。肿瘤可位于肾上腺或肾上腺外，肾上腺外嗜铬细胞瘤又称副神经节瘤。嗜铬细胞瘤的主要症状是高血压，常见伴发症状为头痛、心悸、多汗及直立性低血压；可出现心血管、胃肠道、肾脏、神经、精神等全身多系统症状及多内分泌腺瘤病（MEN）Ⅱ型的相关疾病症状；部分病人糖耐量减退或糖尿病；一般降压药治疗常无效。

影像学检查发现肿瘤后应先做充分的药物治疗准备，必须先服用 α 受体拮抗药，待血压控制和临床症状改善后行手术治疗，如心率增快需加用 β 受体拮抗药则必须在服用 α 受体拮抗药后，绝不能先服 β 受体拮抗药。

5.4.1.1　α 受体拮抗药

甲磺酸酚妥拉明 [保（甲）]

Phentolamine Mesilate

【适应证】嗜铬细胞瘤的高血压危象、嗜铬细胞瘤的药物诊断性试验检查、在手术中控制血压。

【注意事项】（1）做酚妥拉明试验时，需严密监测血压、心率、瞳孔及其他体征变化，保留静脉通路及准备急救药品，以备血压剧降时的急救。（2）降压药、巴比妥类、阿片类镇痛药、镇静药均可造成酚妥拉明试验假阳性，故试验前 24 小时应停用。（3）下列情况慎用：冠状动脉供血不足、心绞痛、心肌梗死患者。

【用法及用量】成人酚妥拉明试验用量：静脉注射一次 5 mg，也可先注入 2.5 mg，若反应阴性，则再给 5 mg；试验前应维持静脉通道，如血压急速下降则根据血压变化情况调整静脉滴注速度。儿童酚妥拉明试验用量：静脉注射一次 1 mg，亦可按体重 0.1 mg/kg 或按体表面积 3 mg/m^2，或肌内注射 3 mg；用于嗜铬细胞瘤手术或嗜铬细胞瘤高血压危象时：如血压急剧增高，成人可每次静脉注射 1 mg，视血压变化，必要时可重复使用，或静脉滴注每分钟 0.5 ~ 1 mg，根据血压变化调整静脉滴注速度。儿童可每次静脉注射 1 mg，亦可按体重 0.1 mg/kg 或按体表面积 3 mg/m^2 决定用量。

【制剂与规格】甲磺酸酚妥拉明注射液：① 1 ml : 5 mg；② 1 ml : 10 mg。

盐酸酚苄明 [保（乙）]

Phenoxybenzamine Hydrochloride

【适应证】用于治疗嗜铬细胞瘤所致的高血压，行手术切除肿瘤前的药物准备或不能手术时的长期治疗。

【注意事项】（1）用药期间需监测血压、心率及其他体征变化；达到满意剂量或病情控制好的标准是阵发性高血压发作基本被控制或无高血压发作；持续性高血压控制到正常或大致正常；病人的高代谢症状改善，体重增加，出汗减少，血容量恢复。（2）给药须按个体化原则，根据临床反应及测定儿茶酚胺水平，及时调整用药剂量。（3）开始宜用小剂量，逐渐增加至最小有效剂量，以减少不良反应；服药过程中应监测卧、立位血压和心率的变化，并嘱病人起立动作要慢一些，以防摔倒。（4）静脉注射给药时，注意补充血容量，以防血压骤降。

【不良反应】常见的有直立性低血压、心动过速或心律失常、鼻黏膜充血而致鼻塞、口干等。

【用法与用量】（1）成人常用量：静脉滴注，用于嗜铬细胞瘤术前应用 3 日，必要时麻醉诱导时给药一次；口服量，开始 5 ~ 10 mg，一日 2 次，根据血压变化调整用量，每次增加 5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 3 次，直至取得疗效，术前准备至少 3 ~ 4 周。平均剂量一日 0.5 ~ 1 mg/kg，大多数病人需服一日 40 ~

80 mg。(2) 儿童常用量：口服可按体重一日 0.2 mg/kg，一日 2 次，或按体表面积 6 ~ 10 mg/m²，一日 1 ~ 2 次，根据血压变化调整用量，至出现疗效。

【制剂与规格】盐酸酚苄明注射液：① 1 ml : 10 mg；② 2 ml : 100 mg。

盐酸酚苄明片：10 mg。

其他 α 受体拮抗药还有如下几类药物。

盐酸哌唑嗪[保(甲)] 治疗嗜铬细胞瘤的初始剂量为 1 mg，逐渐增加到 2 ~ 5 mg，一日 2 ~ 3 次。(其他见 4.3.6)

盐酸特拉唑嗪[保(甲)] 治疗嗜铬细胞瘤初始剂量 1 mg，逐渐增量为 2 ~ 5 mg，一日 1 次。(其他见 8.11.1)

甲磺酸多沙唑嗪[保(乙)] 治疗嗜铬细胞瘤初始剂量 0.5 mg，逐渐增量为 2 ~ 8 mg，一日 1 次。(其他见 8.11.1)

上述药物首次剂量后均可发生直立性低血压，故应嘱病人卧床休息避免摔倒或睡前服用，必要时再逐渐增加剂量。

盐酸乌拉地尔[保(乙)] 治疗嗜铬细胞瘤初始剂量，口服缓释胶囊 30 ~ 60 mg，一日 2 次，随个体血压调整；用于高血压危象时可用静脉注射或静脉滴注。(其他见 4.3.6)

5.4.1.2 β 受体拮抗药

嗜铬细胞瘤病人服用 β 受体拮抗药后出现持续性心动过速(每分钟 > 120 次)或室上性快速心律失常时，可考虑加服 β 受体拮抗药，但绝不能在未使用 β 受体拮抗药的情况下单独或先用 β 受体拮抗药，否则可因此导致严重肺水肿、心力衰竭或诱发高血压危像而加重病情。必要时在特殊情况下也应两者同时使用。在用 α、β 受体拮抗药治疗时，主张达到部分阻断 α 及 β 受体的作用。

普萘洛尔[基(基)，保(甲/乙)] 治疗嗜铬细胞瘤初始剂量为 10 mg，一日 2 ~ 3 次，可逐渐增加剂量以达到控制心率的目的。(其他见 4.7)

阿替洛尔[保(甲)] 常用剂量 25 ~ 50 mg，一日 2 次。(其他见 4.7)

美托洛尔[保(甲/乙)] 常用剂量 50 mg，一日 2 ~ 3 次。(其他见 4.7)

艾司洛尔[保(乙)] 是一种短效的选择性 β_1 受体拮抗药，作用快而短暂，半衰期为 9 分钟，可用于静脉滴注，迅速减慢心率，剂量因个体及病情而定。(其他见 4.7)

5.4.1.3 钙通道阻滞药

硝苯地平[基(基)，保(甲/乙)] 口服：一日 10 ~ 30 mg，作为嗜铬细胞瘤患者的辅助用药。(其他见 4.8.1)

5.4.1.4 血管紧张素转换酶抑制药

血管紧张素转换酶抑制药可通过抑制其肾素 - 血管紧张素系统来降低血压，作为嗜铬细胞瘤患者的辅助用药。常用剂量依药物种类而定。

5.4.1.5 血管扩张药

硝普钠[基(基)，保(甲)] 主要用于嗜铬细胞瘤高血压危象发作或手术中血压持续升高者。本品只能用 5% 葡萄糖溶液溶解和稀释，须临用前配制，并于 12 小时内用完，滴注瓶应用黑纸遮住，避光使用。一般从小剂量开始，逐渐增加至每分钟 50 ~ 200 μg，可用输液泵控制浓度和速度，同时严密监测血压，调整药物剂量，以防血压骤然下降，待血压平稳后停药，再改用上述其他药物。因较长时间连续用药可致氰化物中毒，故孕妇忌用，以免流产或胎儿死亡；同时应监测氰化物的血药浓度。(其他见 4.3.5)

5.4.2 原发性醛固酮增多症及其治疗药物

原发性醛固酮增多症 (primary aldosteronism，简称原醛症) 是一种以高血

压、低血钾或正常血钾、低血浆肾素及高血浆醛固酮水平为主要特征，因肾上腺皮质肿瘤或增生，分泌过多醛固酮所致的继发性高血压，其患病率在所有高血压人群中为 5% ~ 13%，而在顽固性高血压人群中高达 20%。原发性醛固酮增多病人可发生高血压性心、脑、肾损害，服用一般降压药常无显效。

治疗：肾上腺醛固酮分泌腺瘤（APA）病人应首选手术切除肾上腺肿瘤，肾上腺原发性增生（PAH）病人行单侧、次全或双侧肾上腺切除术即可得到满意疗效，特发性醛固酮增多症（IHA）双肾上腺增生病人则趋向于长期药物治疗，常用药物为螺内酯。

联合用钙通道阻滞药硝苯地平和螺内酯对原发性醛固酮增病人行术前准备及非手术病人的长期治疗，剂量为硝苯地平一日 30 ~ 60 mg、螺内酯一日 60 ~ 120 mg，分 3 ~ 4 次口服。如患者肾功能障碍或不能耐受螺内酯的不良反应，也可用硝苯地平同时加用补钾盐治疗，做术前准备或长期服用，视血钾、血压的变化调整剂量。

IHA 及各种不能手术的 APA 腺瘤病人长期治疗服用螺内酯出现不良反应时，可改用氨苯蝶啶或阿米诺利；此外，降压药除可用钙通道阻滞药硝苯地平、尼群地平外，还可用血管紧张素转换酶（ACE）抑制药如卡托普利、依那普利等。

糖皮质激素可治疗的原发性醛固酮增多病人需长期用外源性糖皮质激素治疗，可用一日地塞米松 2 mg，即睡前服 1.5 mg、起床后服 0.5 mg，一般在 2 周内可使血压下降，血钾、醛固酮和 PRA 恢复正常，以后逐渐减量至维持量。但也有病人在长期服用期间因血压控制不好而需加用其他药物如螺内酯、阿米诺利或氨苯蝶啶。

螺内酯[基(基)，保(甲)]

Spironolactone

【适应证】用于原发性醛固酮增多症病人的术前准备和不能手术、肾上腺增生病人的长期治疗。

【注意事项】严重肾功能障碍者、大剂量或长期使用者应经常检查血钾、血钠，血压，调整剂量。

【不良反应】偶有头痛、嗜睡、皮疹及男性乳腺增生、性功能减退、面部多毛症。

【用法与用量】手术前口服，一日 120 ~ 240 mg，分 3 ~ 4 次口服，待血钾恢复正常，血压下降后，可减至维持量一日 60 ~ 100 mg，再择期进行手术。术前至少应服螺内酯 4 ~ 6 周。小儿一日 2 mg/kg，分 3 ~ 4 次服用。

【制剂与规格】螺内酯片：20 mg。

5.4.3 库欣综合征及其治疗药物

库欣综合征（Cushing syndrome）又称皮质醇增多症，是由于肾上腺糖皮质激素分泌过多引起的一系列临床症候群。病因有：下丘脑－垂体功能紊乱导致 ACTH 分泌过多，即双侧肾上腺皮质增生，又称库欣病，最为多见；各种肿瘤所致的异位 ACTH 分泌综合征；良性或恶性肾上腺肿瘤；长期服用较大剂量的糖皮质激素所致的医源性库欣综合征，停药后症状可缓解；原发性结节性肾上腺增生：肾上腺有一个或多个结节，由于 ACTH 以外的某种物质刺激肾上腺引起增生所致。

皮质醇增多症的合理治疗取决于其病因，ACTH 依赖的皮质醇增多症如蝶鞍明显增大，有视交叉压迫症状的垂体 ACTH 瘤，应及时经蝶窦行显微外科垂体微腺瘤摘除术，不能手术或手术失败可行垂体放疗、双侧肾上腺切除术或药物治疗。异位 ACTH 分泌综合征、原发性肾上腺增生、腺瘤或癌肿则首选原发肿瘤或肾上腺病变切除术，无法切除者予以药物治疗。药物治疗包括下述药物。

氨鲁米特[保(甲)] 可抑制多种皮质醇合成酶，阻止皮质醇生成。常用剂量一日 0.75 ~ 1.0 g，分次口服。服药期间需用小剂量肾上腺糖皮质激素，以防止发生肾上腺皮质功能减退危象。有轻度头痛、头晕、嗜睡、皮疹等不良反应。（其他见 10.3.2.1）

米托坦（Mitotane） 选择性作用于肾上腺

皮质网状带和束状带细胞，抑制 11β-羟化酶和胆固醇侧链断裂酶，同时可直接破坏肾上腺皮质细胞且作用持久，导致皮质醇合成减少。适用于各种病因的库欣综合征，尤其适用于肾上腺皮质癌的治疗，常用剂量为一日 4～10g，分次口服，数周至数月后改为维持量，一日 2～4g。不良反应有胃肠道不适、头晕、头痛、皮疹等。

甲吡酮（Metyrapone） 为 11β-羟化酶抑制药，与氨鲁米特合用疗效更佳。起始剂量为一日 1～2g，分次口服，逐渐加量至一日 4～6g。有轻度头痛、头晕等不良反应。

酮康唑[保(乙)] 为咪唑类衍生物，可通过抑制 11β-羟化酶和侧碳链而抑制皮质醇合成，对肾上腺肿瘤疗效迅速。可予一日 0.2～1.0g，从小剂量开始，分次口服。不良反应有恶心、发热、肝功能受损，偶有患者出现急性黄色肝萎缩。（其他见 16.2.2.4）

米非司酮[保(乙)] 对糖皮质激素受体有高度亲和力，可在受体水平拮抗糖皮质激素的作用。常用剂量为每次 200mg，一日 2 次。（其他见 12.10.2）

赛庚啶[基(基)，保(甲)] 为 5-羟色胺拮抗药，可抑制下丘脑释放 CRH 及抑制垂体 ACTH 的分泌，从而降低血浆 ACTH 和皮质醇的水平，常用剂量为一日 12～24mg，分次服用，需长期应用。（其他见 2.6）

溴隐亭[保(乙)] 为多巴胺受体激动药，可使垂体前叶合成 ACTH 减少。常用剂量为一日 7.5～10mg，分次口服。（其他见 5.3.2）

5.4.4 肾上腺皮质激素类药物

5.4.4.1 促皮质激素

促皮质素[保(甲)]

Adrenocorticotropine

【适应证】用于活动性风湿病、类风湿关节炎、红斑性狼疮等胶原性疾患；亦用于严重的支气管哮喘、严重皮炎等过敏性疾病及急性白血病、霍奇金病等。

【注意事项】(1) 本品粉针剂使用时不可用氯化钠注射液溶解，也不宜加入氯化钠中静脉滴注。(2) 由于促皮质素能使肾上腺皮质增生，因此促皮质素的停药较糖皮质激素容易，但应用促皮质素时皮质醇的负反馈作用，下丘脑-垂体-肾上腺皮质轴对应激的反应能力降低，促皮质素突然撤除可引起垂体功能减退，因而停药时也应逐渐减量。(3) 有下列情况应慎用：高血压、糖尿病、结核病、化脓性或真菌性感染、胃与十二指肠溃疡病及心力衰竭患者等。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 由于促皮质素促进肾上腺皮质分泌皮质醇，因此长期使用可产生糖皮质激素的不良反应，出现医源性库欣综合征及明显的水钠潴留和相当程度的失钾。(2) 促皮质素的致糖尿病作用、胃肠道反应和骨质疏松等，系通过糖皮质类固醇引起，但在使用促皮质素时这些不良反应的发生相对较轻。(3) 促皮质素刺激肾上腺皮质分泌雄激素，因而痤疮和多毛的发生率较使用糖皮质激素者为高。(4) 长期使用促皮质素可使皮肤色素沉着。有时产生变态反应，包括发热、皮疹、血管神经性水肿，偶可发生过敏性休克，这些反应在腺垂体功能减退，尤其是原发性肾上腺皮质功能减退者较易发生。在静脉给药对疑有原发性肾上腺皮质功能减退者进行促皮质素试验时，宜口服地塞米松，一日 1mg，以避免诱发肾上腺危象。

【用法与用量】(1) 肌内注射：一次 25U，一日 2 次。(2) 静脉滴注：临用前，用 5% 葡萄糖注射液溶解后应用。一次 12.5～25U，一日 25～50U。(3) 促皮质素兴奋试验：用 5% 葡萄糖注射液 500ml 溶解注射用促皮质素 20～25U，静脉持续滴注 8 小时，滴注前后采血测血浆皮质醇，观察其变化或留滴注促皮质素日尿液以测定尿游离皮质醇或 17-羟皮质激素，与前一日对照值相比较。

【制剂与规格】注射用促皮质素：25U。

5.4.4.2 肾上腺皮质激素的概述

肾上腺皮质激素为一类甾体激素，根据其分泌部位、主要生理和药理作用可分为3类：①由肾上腺皮质束状带分泌的可调节糖、蛋白质、脂肪代谢的糖皮质激素（如氢化可的松等）；②由肾上腺皮质球状带分泌的可调节水、电解质代谢的盐皮质激素（如醛固酮等）；③作用于性器官的氮皮质激素（主要为雄激素）。糖皮质激素主要影响人体的糖、蛋白质和脂肪的代谢，在超过生理剂量时，表现出广泛而显著的药物作用，在临床中应用最多，其具有抗炎、抗过敏、抗病毒、抑制多种炎症细胞（抑制嗜酸性粒细胞、中性粒细胞、单核细胞、巨噬细胞、肥大细胞等的趋化、游走、聚集），增加人体对有害刺激的抵抗能力，控制气道高反应性，免疫抑制和对抗表皮细胞的增生等诸多作用，是内分泌、肾脏、血液、风湿免疫、变态反应、眼科、耳鼻咽喉科和皮肤科疾病的主要治疗药物之一，主要用于替代治疗和药物治疗，在内分泌科还用于疾病的诊断用药。

（1）糖皮质激素替代治疗：糖皮质激素适用于腺垂体功能减退症，急性、慢性肾上腺皮质功能减退症，先天性肾上腺皮质增生症，肾上腺皮质醇瘤手术后及肾上腺次全切除术后的替代治疗。在重症原发性肾上腺皮质功能减退症治疗中，须加用盐皮质激素，常用氢化可的松联合盐皮质激素氟氢可的松进行替代治疗。

急性肾上腺皮质功能不全（肾上腺皮质危象），需要由静脉补充氢化可的松，可在最初24小时内将氢化可的松琥珀酸钠100 mg溶于氯化钠注射液中静脉滴注，每6～8小时给予1次，待病情改善后，逐渐减量，再改为口服维持量。

慢性原发性肾上腺皮质功能减退症（阿狄森病）治疗的起始剂量为口服氢化可的松一日20～30 mg，为模拟生理分泌曲线，宜将全日2/3用量于清晨服用，1/3于下午服用。剂量应个体化并根据临床反应进行调整，于应激时增加剂量。血压偏低者可一日口服补充氟氢可的松0.05～0.2 mg。

腺垂体功能减退者，可用泼尼松一日5～10 mg或氢化可的松20～30 mg补充或替代治疗，2/3用量于清晨服用，1/3于下午服用，根据病情酌情补充甲状腺激素和性激素。

先天性肾上腺皮质增生症需服用糖皮质激素补充肾上腺皮质功能不足，又同时抑制促肾上腺皮质激素（ACTH）的过量分泌，从而抑制肾上腺皮质增生，减少雄激素及其他中间代谢产物的分泌。儿童一般一日服用氢化可的松10～20 mg、成人服用泼尼松一日5～10 mg，或地塞米松一日0.75～1.5 mg，于晚上睡觉前服用或1/3用量于清晨服用，2/3于下午服用。服药后要根据临床症状和上述激素水平调整剂量。

（2）糖皮质激素的药物治疗：除替代治疗外，利用糖皮质激素的抗炎、抗过敏和免疫抑制等作用，用于人体的过敏性、炎症性与自身免疫性疾病的治疗。包括过敏性疾病（支气管哮喘、血管神经性水肿、过敏性鼻炎等）；炎症性疾病（阶段性结肠炎、溃疡性结肠炎、损伤性关节炎等）；自身免疫性疾病（系统性红斑狼疮、多发性皮肌炎、风湿病、血管炎、肾病综合征、重症肌无力等）；血液疾病（急性白血病、淋巴瘤等）以及器官移植的抗排斥反应（心、肝、肾、肺组织移植）等。此外，其外用制剂也可用于眼科、耳鼻喉科、皮肤科的炎症和过敏性疾病的治疗。

在应用生理剂量的糖皮质激素替代治疗时，无明显不良反应，但在超过生理剂量的药物治疗时，常见明显不良反应，且与剂量、疗程、用法、给药途径密切相关。

糖皮质激素的糖、盐皮质激素作用强度、效价和等效剂量，见表5-1。

5.4.4.3 糖皮质激素的应用原则

（1）糖皮质激素无对抗细菌等病原微生物感染的作用，非生理剂量的糖皮质激素对抗感染不利，并且非肾上腺皮质功能减退者在应用药物剂量后易发生感染，故对患有活动性肺结核者及肺部真菌、病毒感染者慎用。如全身或皮肤合并各种感染时，应酌情联合应用有效抗生素等；并发全身过敏时，应同服组胺拮抗药。在某些感染时用糖皮质激素又可减轻组织破坏、

表 5-1 常用糖皮质激素的作用强度、效价和等效剂量比

药 物	作用持续时间（小时）	糖皮质激素作用（抗炎）	盐皮质激素作用（钠潴留）	等效剂量（mg）	血浆半衰期（分钟）
氢化可的松	8 ~ 12	1	1	20	90
可的松	8 ~ 12	0.8	0.8	25	30
泼尼松	12 ~ 36	4	0.8	5	60
泼尼松龙	12 ~ 36	4	0.8	5	200
甲泼尼龙	12 ~ 36	5	0.5	4	180
地塞米松	36 ~ 54	20 ~ 30	0	0.75	100 ~ 300
倍他米松	36 ~ 54	20 ~ 30	0	0.6	100 ~ 300

减少渗出、减轻感染中毒症状，但须同时用有效的抗菌药物治疗。治疗时应密切观察病情变化，待病情好转后迅速减量或停药。

(2) 糖皮质激素可透过胎盘，其药物治疗剂量可增加胎盘功能不全、新生儿体重减少或死胎的发生，但尚未证明对人类有致畸作用。妊娠妇女接受糖皮质激素治疗者，应观察婴儿是否有肾上腺皮质功能减退的表现。糖皮质激素可通过乳汁哺乳对婴儿生长发育、肾上腺皮质功能产生不良影响，故对早产儿、儿童、妊娠妇女慎用。

(3) 糖皮质激素治疗皮肤病多采用局部给药，如用洗剂、溶液剂、软膏和乳膏剂等，患部可仅涂一层薄膜，一日用药 1 ~ 2 次，待病情控制后即减少用药次数。对用量较大的激素依赖性哮喘患者，可用吸入剂替代口服给药，并在吸入后漱口以去除残留药物所可能诱发的口腔真菌感染和溃疡。

(4) 局部应用糖皮质激素可致高吸收区如面、颈、腋窝、会阴、生殖器的表皮和真皮萎缩，皮肤变薄，出现皮纹、毛细血管扩张和紫癜等；老年人尤甚，在使用时应注意。

(5) 初始剂量宜小而停药时间应缓慢，长期应用糖皮质激素会引起肾上腺皮质萎缩和功能不全，一旦减量过快、突然停药或在停药期间有感染、创伤、出血等应激状况，可诱发肾上腺危象。

(6) 糖皮质激素分泌具有昼夜节律，一日上午 6–8 时为分泌高峰（约 450 nmol/L），随后逐渐下降（下午 4 时约 110 nmol/L），午夜 12 时为低谷，其与 ACTH 昼夜节律一致。临床用药如遵循内源性分泌节律，则对肾上腺皮质功能的抑制较小。

(7) 吸入性糖皮质激素需依据持续型哮喘的严重程度给予适当剂量，起始剂量依据病情严重程度分为轻、中和重度持续给予，维持剂量应以能控制临床症状和气道炎症的最低剂量确定，分 2 ~ 4 次给予，一般连续应用 2 年。

(8) 对急性哮喘、气道平滑肌痉挛严重的患者，一般不单用糖皮质激素吸入，而应联合使用长效 β_2 受体激动药。

(9) 用药期间如出现高血压、糖尿病、消化道溃疡、低血钾、骨质疏松和细菌感染等，应给予相应治疗，必要时应停药。

对长期应用糖皮质激素的患者，应定期监测：①血糖、尿糖或糖耐量试验，尤其是有糖尿病或糖尿病倾向者；②小儿应定期监测生长和发育情况；③眼科检查有无白内障、青光眼或眼部感染；④血清电解质和大便隐血；⑤高血压和骨质疏松的检查，对老年人尤应注意。

氢化可的松 [基（基），保（甲）]

Hydrocortisone

【适应证】①原发性或继发性肾上腺皮质功能减退症的替代治疗。②先天性肾上腺皮质增生症。③自身免疫性疾病，如系统性红斑狼疮、重症多发性皮肌炎、风湿病、风湿性关节炎、皮肌炎、自身免疫性出血、血管炎、肾病综合征等、血小板减少性紫癜、重症肌无力。④过敏性疾病，严重支气管哮喘、血管神经性水肿、血清病、过敏性鼻炎。⑤用于器官移植的

抗排斥反应，如心、肝、肾、肺组织移植。⑥治疗各种急性中毒性感染、病毒感染，如细菌性痢疾、中毒性肺炎、重症伤寒、结核性脑膜炎、胸膜炎。⑦血液疾病，如急性白血病、淋巴瘤等。⑧用于炎症性疾患，如阶段性结肠炎、溃疡性结肠炎、损伤性关节炎。其他外用制剂可用于眼科、皮肤科的炎症和过敏性疾病。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用，儿童尽量应用小剂量。(2) 未控制的结核性、化脓性、细菌性和病毒性感染者忌用。(3) 心脏病、急性心力衰竭、高脂蛋白血症、高血压、甲状腺功能减退、重症肌无力、肾功能损伤、肾结石患者慎用。(4) 频繁应用可引起局部组织萎缩，易引起继发感染（真菌）。用糖皮质激素治疗的患者在发生感染后因炎症反应轻微、症状不明显而易漏诊；而某些感染时应用本品可减轻组织破坏，减少渗出、减轻感染症状，但须同时用有效抗生素治疗，并密切观察病情的变化。(5) 氢化可的松注射液中含有乙醇，必须稀释至 0.2 mg/ml 浓度后滴注；对中枢神经系统受抑制、肝功能受损者宜选择氢化可的松琥珀酸钠注射液。(6) 长期应用可发生低钾、低钙、负氮平衡和垂体 - 肾上腺皮质功能抑制，应补充钾、钙、蛋白质饮食，必要时配合蛋白同化激素等，并限制糖摄入，采用保护肾上腺皮质功能的措施。

【禁忌证】肾上腺皮质激素过敏者、有严重精神病史、癫痫、活动性消化性溃疡、新近胃肠吻合术者、肾上腺皮质功能亢进、严重骨质疏松、青光眼、严重糖尿病者禁用。

【不良反应】偶见局部组织刺激、过敏反应、皮肤瘙痒、烧灼感或干燥感；长期大量应用可致皮肤萎缩、色素脱失、毛细血管扩张、酒渣样皮炎、口周皮炎、医源性库欣综合征表现（如满月脸、向心性肥胖、皮肤紫纹、出血倾向、痤疮、糖尿病倾向、高血压、骨质疏松或骨折、低血钙、低血钾等）；动脉粥样硬化、下肢水肿、创面愈合不良、月经紊乱、股骨头坏死、儿童生长发育受抑制、有欣快感、激动、烦躁不安、定向力障碍等精神症状；其他不良反应如肌无力、肌萎缩、胃肠道反应、恶心、呕吐、消化性溃疡、肠穿孔、胰腺炎、水钠潴留、青光眼、白内障、眼压增高、颅内压增高等。少见用药后血胆固醇、脂肪酸升高，白细胞、淋巴细胞、单核细胞、嗜酸性粒细胞、嗜碱性粒细胞计数下降，血小板计数下降或增加。若快速静脉滴注大剂量可发生全身性过敏反应，如面部、鼻黏膜及眼睑肿胀、荨麻疹、气短、胸闷、喘鸣等。外用偶见有局部烧灼感、瘙痒、刺激及干燥感，若长期、大面积使用，可能导致皮肤萎缩、毛细血管扩张、皮肤条纹及痤疮，甚至出现全身性不良反应。

【用法与用量】(1) 口服：①用于抗炎和免疫抑制，一日 2.5 ~ 10 mg/kg，分 3 ~ 4 次给药，每 6 ~ 8 小时给药 1 次。②用于替代治疗及先天性肾上腺皮质增生症治疗，见糖皮质激素替代治疗。(2) 静脉滴注：用于各种危重病例的抢救，一次 100 ~ 200 mg；每 6 ~ 8 小时给予 1 次，待病情改善后，逐渐减量，连续应用不宜超过 3 ~ 5 日。(3) 鞘内注射：一次 25 ~ 50 mg，摇匀后关节腔内或鞘内注射。

【制剂与规格】氢化可的松注射剂 (0.5 %)：① 2 ml : 10 mg；② 5 ml : 25 mg；③ 20 ml : 100 mg。

醋酸氢化可的松注射（混悬液）剂 (2.5%)：5 ml : 125 mg。

注射用氢化可的松琥珀酸钠：① 67.5 mg（以氢化可的松计 50 mg）；② 135 mg（以氢化可的松计 100 mg）。

醋酸氢化可的松注射剂：5 ml : 125 mg。

氢化可的松片剂：① 4 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

醋酸氢化可的松片剂：20 mg。

氢化可的松乳膏：① 0.25%，10 g : 25 mg；② 0.5%，10 g : 50 mg。

丁酸氢化可的松乳膏 (0.1%)：10 g : 10 mg。

氢化可的松眼膏 (0.25%)：4 g : 10 mg。

地塞米松[基(基)，保(甲/乙)]

Dexamethasone

【适应证】适用于过敏性、炎症性与自身免疫性疾病。其他参见氢化可的松。

第5章 内分泌代谢疾病用药

可用于库欣综合征的诊断和鉴别诊断药物试验；糖皮质激素可治疗性醛固酮增多症的诊断试验。

【注意事项】(1) 用药过程中应监测患者的血红蛋白、血糖、血清钾、血压的变化，并注意是否有隐性出血。(2) 对眼部感染性炎症治疗，应与有效的抗生素联合应用，病情好转后逐渐减少用药次数，不可骤停，以减少复发。(3) 本品因其盐皮质激素活性很弱，不适用于原发性肾上腺皮质功能不全症的替代治疗。其余参见氢化可的松。

【禁忌证】见氢化可的松

【不良反应】少见有水钠潴留、血糖升高；静脉注射可引起肛门生殖区的感觉异常或激惹；长期应用可致医源性库欣综合征，表现有满月脸、向心性肥胖、紫纹、出血倾向、痤疮、糖尿病倾向、高血压、骨质疏松或骨折。其他可参见氢化可的松。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：①用于各种危重病例的抢救，一次 2 ~ 20 mg，每 2 ~ 6 小时重复给药，直至病情稳定；②用于预防妇科手术硬膜外麻醉所引起的恶心和呕吐，于术后注射 5 ~ 10 mg；③用于治疗恶性肿瘤所致的脑水肿，首次 10 mg，随后每 6 小时给予 4 mg 肌内注射，儿童负荷量 1.5 mg/kg，随后以一日 1.5 mg/kg 维持，连续 5 日；④用于急性非淋巴细胞白血病，一次 2 mg/m^2，每隔 8 小时重复给药 1 次，连续 12 次。(2) 肌内注射：①用于恶性疟疾所致的脑水肿，一次 3 ~ 10 mg，每隔 8 小时重复给予 1 次；②用于过敏性休克或过敏性疾病，一次 2 ~ 6 mg，严重者每 2 ~ 6 小时重复给药。(3) 关节腔内注射：一次 0.8 ~ 4 mg，剂量可视关节腔大小酌情而定。(4) 口服：初始一次 0.75 ~ 3 mg，一日 2 ~ 4 次，维持量一日 0.75 mg，剂量可视病情酌情而定。(5) 地塞米松抑制试验：① 1 mg（午夜 12 点口服），地塞米松抑制试验可用于库欣综合征的筛查；② 2 mg（口服一次 0.5 mg，每 6 小时服 1 次，共服 2 日），小剂量地塞米松抑制试验可用于库欣综合征的定性诊断；③ 8 mg（口服一次 2 mg，每 6 小时服 1 次，共服 2 日），大剂量地塞米松抑制试验可用于库欣综合征的分型诊断，即鉴别是垂体 ACTH 瘤、异位 ACTH 综合征还是肾上腺肿瘤。(6) 地塞米松 - 醛固酮抑制试验（口服一次 0.5 mg，每 6 小时服 1 次，共服 21 日）：鉴别是否为糖皮质激素可治疗性醛固酮增多症。

【制剂与规格】地塞米松片：0.75 mg。

地塞米松磷酸钠注射液：① 1 ml ∶ 1 mg；② 1 ml ∶ 2 mg；③ 1 ml ∶ 5 mg。

醋酸地塞米松注射剂：① 0.5 ml ∶ 2.5 mg；② 1 ml ∶ 5 mg；③ 5 ml ∶ 25 mg。

地塞米松磷酸钠滴眼剂（0.5%）：5 ml ∶ 25 mg。

地塞米松乳膏(0.05%)：5 g ∶ 2.5 mg。

醋酸地塞米松粘贴片：0.3 mg。

泼尼松[基(基)，保(甲)]

Prednisone

【适应证】适用于过敏性与自身免疫性炎症性疾病。(1) 重症多发性皮肌炎、严重支气管哮喘、风湿病、血管炎、溃疡性结肠炎、肾病综合征等。(2) 治疗各种急性严重性细菌感染、重症肌无力。(3) 血小板减少性紫癜、粒细胞减少症、肾上腺皮质功能减退症。(4) 用于器官移植的抗排斥反应。(5) 过敏性疾病、结缔组织病（系统性红斑狼疮、结节性动脉周围炎等）。(6) 剥脱性皮炎、药物性皮炎、天疱疮、神经性皮炎、荨麻疹、湿疹等皮肤疾病。(7) 用于肿瘤如急性淋巴性白血病、恶性淋巴瘤。(8) 滴眼液用于结膜炎、角膜炎和眼前段组织炎症。

【注意事项】(1) 妊娠妇女、高血压、糖尿病、消化性溃疡、精神病、青光眼患者慎用。(2) 对长期应用本品者，在手术时及术后 3 ~ 4 日常需酌增用量，以防肾上腺皮质功能不全。一般外科患者应尽量不用，以免影响伤口的愈合。(3) 与抗菌药物并用于细菌感染疾病时，应先使用抗菌药物，而在停用抗菌药物之前停药，以免掩盖症状，延误治疗。

【禁忌证】(1) 对糖皮质激素过敏者。(2)活动性肺结核者。(3)严重精神疾病者、癫痫、活动性消化性溃疡、糖尿病、新近胃肠吻合手术、骨折、创伤修复期、角膜

溃疡、未能控制的感染者、较重的骨质疏松者。(4) 未进行抗感染治疗的急性化脓性眼部感染者。(5) 泼尼松滴眼剂对急性化脓性眼部感染、急性单纯疱疹病毒性角膜炎，牛痘、水痘及其他大多数角膜病毒感染者。

【不良反应】由本品所致的水、钠潴留作用较可的松弱，长期超生理剂量的应用，可出现并发感染、向心性肥胖、满月脸、紫纹、皮肤变薄、肌无力、肌萎缩、低血钾、水肿、恶心、呕吐、高血压、糖尿病、痤疮、多毛、感染、胰腺炎、伤口愈合不良、骨质疏松、诱发或加重消化道溃疡、儿童生长抑制、诱发精神症状等。滴眼可引起眼压升高，导致视神经损害、视野缺损、后囊膜下白内障、继发性真菌或病毒感染等。其他不良反应见氢化可的松。

【用法与用量】(1) 口服：一般一次 5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 3 次，一日 10 ~ 60 mg。①用于系统性红斑狼疮、溃疡性结肠炎、肾病综合征、自身免疫性贫血等，一日 40 ~ 60 mg，病情稳定后逐渐减量。②用于药物性皮炎、支气管哮喘、荨麻疹等过敏性疾病，一日 20 ~ 40 mg，症状减轻后逐渐减量，每间隔 1 日减少 5 mg。③用于急性淋巴性白血病及恶性淋巴瘤，一日 60 ~ 80 mg，待症状缓解后减量。(2) 外用：用于过敏性皮炎、湿疹，用量依病变大小和用药部位而定，一日 1 ~ 2 次。(3) 滴眼：一次 1 ~ 2 滴，一日 2 ~ 4 次。

【制剂与规格】泼尼松片：5 mg。

泼尼松滴眼剂 (0.5%)：① 5 ml；② 10 ml。

泼尼松眼膏 (0.5%)：3 g : 15 mg。

泼尼松龙 [保(乙)]

Prednisolone

【适应证】用于各种急性严重细菌感染、过敏性疾病、结缔组织病（红斑狼疮、结节性动脉周围炎等）、风湿病、肾病综合征、严重的支气管哮喘、血小板减少性紫癜、粒细胞较少症、急性淋巴性白血病、各种肾上腺皮质功能不足症、剥脱性皮炎、天疱疮、神经性皮炎、湿疹等症。泼尼松龙无需经肝脏转化可直接发挥效应，适用于肝功能不全者。滴眼用于睑球结膜炎、角膜炎和眼前段组织炎症。

【注意事项】(1) 对长期应用本品的患者，在手术时及术后 3 ~ 4 日常需酌增用量，以防肾上腺皮质功能不足。一般外科患者应尽量不用，以免影响伤口的愈合。(2) 与抗菌药物并用于细菌感染疾病时，应在抗菌药使用之后使用，而停药则应在停用抗菌药物之前，以免掩盖症状，延误治疗，尤其对结核病活动期者慎用。(3) 本品因其盐皮质激素活性很弱，故不适用于原发性肾上腺皮质功能不全症。急性化脓关节炎者不宜进行关节内注射。(4) 过量应用可引起全身性不良反应。(5) 泼尼松龙磷酸钠水溶性强，作用快速，可提供肌内、静脉注射和滴注；醋酸泼尼松龙为混悬液吸收缓慢，可供肌内和关节腔内注射。

【禁忌证】(1) 对糖皮质激素过敏者。(2) 活动性肺结核者。(3) 未进行抗感染治疗的急性化脓性眼部感染者。(4) 妊娠期妇女。(5) 严重精神疾病者、癫痫、活动性消化性溃疡、糖尿病、新近胃肠吻合手术、骨折、创伤修复期、角膜溃疡、未能控制的感染者、较重的骨质疏松者。

【不良反应】由本品所致的水、钠潴留作用较氢化可的松弱，一般不易引起水钠潴留和电解质紊乱。长期超生理剂量的应用，可出现向心性肥胖、满月脸、紫纹、皮肤变薄、肌无力、肌萎缩、低血钾、水肿、恶心、呕吐、高血压、糖尿病、痤疮、多毛、感染、胰腺炎、伤口愈合不良、骨质疏松、诱发或加重消化道溃疡、儿童生长抑制、诱发精神症状等。眼部长期大量应用，可引起眼压升高，导致视神经损害、视野缺损、后囊膜下白内障、继发性真菌或病毒感染等。

【用法与用量】(1) 静脉注射或静脉滴注：用于过敏性、自身免疫性及炎症性疾病，泼尼松龙磷酸酯钠一次 10 ~ 20 mg。(2) 肌内或关节腔内注射：一次 5 ~ 25 mg，用量依关节大小和用药部位而定，应在无菌条件下操作以防引起感染。(3) 口服：一日 10 ~ 60 mg，儿童一日 1 ~ 2 mg/kg，分 2 ~ 3 次给药。(4) 滴眼：一次 1 ~ 2 滴，一日 2 ~ 4 次。

【制剂与规格】泼尼松龙磷酸酯钠注射液：5 ml ∶ 125 mg。

泼尼松龙注射液：① 1 ml ∶ 25 mg；② 5 ml ∶ 125 mg。

泼尼松龙滴眼剂（1%）：① 5 ml ∶ 50 mg；② 10 ml ∶ 100 mg。

醋酸泼尼松龙片：5 mg。

甲泼尼龙[保(乙)]

Methylprednisolone

【适应证】用于危重疾病的急救用药，目前临床上主要用于脏器移植的抗排斥反应。

【注意事项】(1) 妊娠期及哺乳期妇女慎用。(2) 甲泼尼龙醋酸酯分解缓慢，作用较持久，可用于肌内注射达到持久的全身效应，也可关节腔内注射，甲泼尼龙琥珀酸钠水溶性强，可供肌内注射、静脉滴注。(3) 由于本品水、钠潴留作用较弱，一般不用作肾上腺皮质功能减退的替代治疗。(4) 大剂量（>0.5 g）而又快速注射或静脉滴注有可能引起心律不齐甚至循环衰竭。(5) 同其他肾上腺皮质激素类一样，用于败血症休克疗效不确切，而且可能增加患者病死率。若长期治疗后需停药时，建议逐渐减量，不可突然停药。(6) 治疗期间不应接种天花疫苗，以免引起神经系统并发症。(7) 注意用药时可能掩蔽感染症状或并发新感染。

【禁忌证】见氢化可的松。

【不良反应】大剂量可致心律失常。其他见氢化可的松。

【用法与用量】(1) 静脉注射、静脉滴注或肌内注射：①用于危重疾病的急救用药，推荐剂量一次 30 mg/kg，静脉给药时间不得少于 30 分钟。此剂量可在 48 小时内，每 4 ~ 6 小时重复给药 1 次。②用于风湿性疾病，一日 1 g，静脉给药 1 ~ 4 日，或一日 1 g，使用 6 个月。③用于系统性红斑狼疮，一日 1 g，静脉给药 3 日。④用于多发性硬化症，一日 1 g，静脉注射 3 日或 5 日。⑤用于肾盂肾炎、肾炎性狼疮等症，30 mg/kg，隔日静脉给药 1 次，连续 4 日。⑥用于防止癌症化疗引起的恶心和呕吐，对轻、中度性呕吐，化疗前 1 小时，化疗初始之际及患者出院时，各以 5 分钟以上时间，静脉给予 250 mg。⑦对严重性呕吐，于化疗前 1 小时，给予 250 mg 本品及适当剂量的甲氧氯普胺，然后于化疗期间及出院时，再各静脉注射 250 mg 本品。⑧用于脏器移植，一日 40 ~ 80 mg，一日 1 次或数次。肾移植可在 24 ~ 48 小时给药 0.5 ~ 2 g，并继续治疗，直至病情稳定，一般不超过 48 ~ 72 小时。⑨用于其他适应证，剂量可自 10 ~ 500 mg，依病情决定。病情危重时，可在短期间内用较大剂量。婴儿及儿童剂量可酌减。24 小时的用量不低于 0.5 mg/kg。(2) 口服：初始一次 4 ~ 24 mg，一日 1 ~ 2 次，维持量一次 4 ~ 8 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】甲泼尼龙片：① 2 mg；② 4 mg。

甲泼尼龙醋酸酯注射液：① 1 ml ∶ 20 mg；② 1 ml ∶ 40 mg。

注射用甲泼尼龙琥珀酸钠：① 40 mg；② 125 mg；③ 500 mg。

倍氯米松[保(乙)]

Beclomethasone

【适应证】用于需长期全身应用皮质激素的慢性支气管哮喘患者，以防止哮喘急性发作；其他如非激素类药治疗无效的哮喘患者、常年性及季节性过敏性鼻炎和血管收缩性鼻炎、各种急性或慢性湿疹，过敏性皮炎、神经性皮炎、接触性皮炎、银屑病等疾病。

【注意事项】(1) 儿童、孕妇慎用；对活动性肺结核患者应特别慎重。(2) 有的患者吸入后可有声音嘶哑，可暂停吸入。长期连续吸入可有口腔念珠菌感染（女性多于男性），可用抗真菌药治疗。(3) 外用时对伴有皮肤细菌、病毒感染的湿疹、疱疹水痘、皮肤结核、化脓性感染和皮炎者原则上不得使用本品。如须使用时，应同时使用抗感染药。(4) 本品与血管扩张药不同，不能立即产生疗效，应定时使用。对哮喘者在症状控制后逐渐停药，一般在应用后 4 ~ 5 日缓慢减量。气雾剂注意防止受热和撞击。

【禁忌证】(1) 在吸入治疗时对哮喘持续状态或其他急性哮喘发作者。(2) 对

本品及赋形剂过敏者。(3) 鼓膜穿孔的湿疹性外耳道炎、溃疡。(4) 孕妇和婴幼儿避免大面积长期使用。

【不良反应】皮肤用药部位可出现皮肤变薄和毛细血管扩张。用于哮喘吸入治疗时，偶见声音嘶哑。长期应用，可发生口腔咽喉念珠菌感染。如果剂量过大（一日＞0.8 mg），可出现糖皮质激素的一系列全身性不良反应。其他见氢化可的松。

【用法与用量】(1) 气雾吸入：一次 50 ~ 200 μg，一日 3 ~ 4 次；儿童一次 50 ~ 100 μg，一日 2 ~ 4 次。(2) 外用：涂敷皮肤患处，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】倍氯米松气雾剂：10 mg，每揿 50 μg。

倍氯米松鼻气雾剂：10 mg，每揿 50 μg。

丙酸倍氯松气雾剂：0.1%，14 mg，每揿 50 μg。

倍氯米松软膏：① 0.025%，4 g；② 0.05%，4 g。

曲安西龙[保(乙)]

Triamcinolone

【适应证】用于类风湿关节炎、其他结缔组织疾病、支气管哮喘、过敏性皮炎、神经性皮炎、银屑病、扁平苔藓、皮肤湿疹等，尤适用于对其他皮质激素禁忌的伴有高血压或水肿的关节炎患者。

【注意事项】(1) 心脏病、急性心力衰竭、高血压、高脂蛋白血症、糖尿病、甲状腺功能减退症、重症肌无力、青光眼、胃炎、食管炎、骨质疏松、肝肾功能不全、妊娠期妇女、情绪不稳定或有精神病倾向者慎用。(2) 对特发性血小板减少性紫癜者禁止肌内注射给药。(3) 外用后有明显局部刺激者应及时停药。

【禁忌证】糖皮质激素过敏、各种细菌感染、全身性真菌感染、严重精神病、活动性消化性溃疡、严重高血压、糖尿病、新近胃肠吻合手术、骨折、创伤修复期、角膜溃疡、未能控制的感染、严重骨质疏松、伴有感染的活动期关节炎、皮炎禁用。

【不良反应】本品所致的不良反应较轻，常见厌食、眩晕、头痛、嗜睡等，但一般不引起水肿、高血压、满月脸等反应，长期使用或用量较大时可致胃溃疡、血糖升高、骨质疏松、肌肉萎缩、肾上腺功能减退及诱发感染等。其他参见氢化可的松。

【用法与用量】(1) 口服：初始一次 4 mg，一日 2 ~ 4 次，维持量一次 1 ~ 4 mg，一日 1 ~ 2 次。(2) 肌内注射：一次 40 ~ 80 mg，1 ~ 4 周 1 次。(3) 皮下注射：一次 5 ~ 25 mg，一周 1 ~ 2 次。(4) 关节腔内注射：一次 10 ~ 25 mg，1 ~ 7 周 1 次。(5) 外用：乳膏剂涂敷患部，一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】曲安西龙片：4 mg。

曲安西龙双醋酸酯混悬注射液：① 5 ml : 125 mg；② 5 ml : 200 mg。

曲安西龙软膏剂：0.025%，10 g。

曲安奈德[保(乙)]

Triamcinolone Acetonide

【适应证】用于神经性皮炎、湿疹、银屑病等皮肤病，过敏性鼻炎，关节痛，支气管哮喘，肩周炎，腱鞘炎，滑膜炎，急性扭伤，风湿性关节炎，慢性腰腿痛及眼科炎症等。

【注意事项】本品不宜做静脉注射，使用前应将药瓶充分摇匀，使药液成均匀悬浮液。关节腔内注射可能引起关节损害。长期用于眼部可引起眼内压升高。

【禁忌证】患有病毒性、结核性或急性化脓性眼病禁用；孕妇不宜长期使用。

【不良反应】本品注射剂量比口服用量小，不良反应少，且短暂而轻微；常见有全身性荨麻疹、支气管痉挛、厌食、眩晕、头痛、嗜睡、月经紊乱、视力障碍，少数患者出现双颊潮红现象；长期应用可导致胃溃疡、血糖升高、骨质疏松、肌肉萎缩、肾上腺萎缩和功能减退及诱发感染等，但一般不会引起水肿、高血压、满月脸等症状。其他参见氢化可的松。

【用法与用量】(1) 肌内注射：用于支气管哮喘，一次 40 mg，每 3 周 1 次，连续 5 次为 1 个疗程，症状较重一次 80 mg；6 ~ 12 岁儿童剂量减半，在必要时 3 ~ 6 岁儿童可用成人剂量的 1/3；用于过敏性鼻炎，一次 40 mg，每 3 周 1 次，连续 5 次为 1 个疗程；或下鼻甲注射，鼻腔先喷 1%的利多卡因液表面麻醉后，在

双下鼻甲前端各注入本品5～20 mg，一周1次，连续5次为1个疗程。(2) 关节或局部注射：用于各种骨关节病，一次2.5～20 mg，溶于0.25%利多卡因10～20 ml中，用5号针头，一次进针直至病灶，一周2～3次或隔日1次，症状好转后一周1～2次，4～5次为1个疗程；用于皮肤病，直接注入皮损部位，通常每一部位用0.2～0.3 mg，视患部大小而定，每处一次不超过0.5 mg，必要时每隔1～2周重复使用。(3) 外用：应用软膏、乳膏剂涂敷患处，一日1～4次。(4) 滴眼：一次1～2滴，一日1～4次。(5) 气雾剂喷布：一次1～2揿，一日3～4次。

【制剂与规格】曲安奈德注射液：① 1 ml : 40 mg；② 2 ml : 80 mg。

曲安奈德软膏：① 0.025%，10 g；② 0.05%，10 g。

醋酸曲安奈德-尿素软膏：每支10 g，含醋酸曲安奈德10 mg、尿素1g。

曲安奈德滴眼液：1 ml : 40 mg。

曲安奈德鼻喷雾剂：6 ml : 6.6 mg，每揿0.055 mg。

曲安奈德气雾剂：1 g : 0.147 mg。

醋酸曲安奈德鼻喷雾剂：10 g : 14 mg，每揿0.12 mg。

复方醋酸曲安标德滴耳剂：10 ml : 醋酸曲安奈德0.1%，氯霉素1.5%。用于急慢性中耳炎，外耳道炎及耳部湿疹等。一次2～3滴，一日3次，小儿1滴。

5.4.4.4 盐皮质激素的应用原则

氟氢可的松

Fludrocortisone

为氢化可的松的氟化衍生物，其糖代谢及抗炎作用较氢化可的松强15倍，而潴钠作用为氢化可的松的100倍以上，因此可和糖皮质激素一起替代治疗重症原发性肾上腺皮质功能减退症。

【适应证】用于重症原发性肾上腺皮质功能减退症的替代治疗；低肾素性低醛固酮综合征；自主神经病变所致的直立性低血压。局部用于皮肤脂溢性湿疹、接触性皮炎和肛门、阴部瘙痒。

【注意事项】(1) 在妊娠期、肝病、黏液水肿者，本品的血浆半衰期和作用时间延长，因此，剂量应适当减小，以防止钠潴留过度、水肿和低钾血症。(2) 用药期间可给予低钠、高钾饮食。其他可参见氢化可的松。

【禁忌证】参见氢化可的松。

【不良反应】多见有水钠潴留、水肿。

【用法与用量】(1) 口服：用于替代治疗，成人一日0.1～0.2 mg，分2次给予。(2) 外用：局部涂敷，一日2～4次。

【制剂与规格】氟氢可的松片：0.1 mg。

醋酸氟氢可的松乳膏剂 (0.025%)：5 g : 1.25 mg。

5.5 甲状旁腺疾病及骨质疏松症用药

5.5.1 甲状旁腺功能亢进症及其药物治疗

甲状旁腺功能亢进症 (hyperparathyroidism) 简称甲旁亢，可分为原发性、继发性、三发性和假性4种。原发性甲状旁腺功能亢进是由于甲状旁腺本身病变引起的甲状旁腺素 (parathyroid hormone, PTH) 合成、分泌过多；继发性甲状旁腺功能亢进是由于各种原因所致的低钙血症，刺激甲状旁腺，使之增生，分泌过多的PTH；三发性甲状旁腺功能亢进是在继发性甲状旁腺功能亢进基础上，甲状旁腺组织由增生转变为腺瘤，自主分泌过多PTH；假性甲状旁腺功能亢进是由于某些恶性肿瘤分泌PTH，致血钙升高。当患者反复发作泌尿系结石、肾钙质沉着、骨痛、骨质吸收、脱钙等应疑为本症。如结合血钙、尿钙增高、PTH增高、血磷降低、X线骨质弥漫脱钙、骨质疏松即可肯定诊断。

原发性甲状旁腺功能亢进以手术治疗为主，如为腺瘤，做腺瘤切除；如为增生，则主张切除1/3～1/2个腺体或全部切除，取少部分组织做甲状旁腺自体移植；如为腺癌则行根治手术。甲状旁腺功能亢进出现高钙血症时则先用药物治疗并尽快行手术治疗。

5.5.1.1 二膦酸盐类

磷酸钙是骨盐的重要组成部分，无机焦磷酸盐可与磷酸钙强力结合，抑制磷酸钙晶体的形成和溶解。二膦酸盐以P–C–P键取代焦磷酸盐中的P–O–P结构，与羟磷灰石有高度亲和性，可抑制晶体的聚集和溶解，抑制破骨细胞活性；通过成骨细胞间接抑制骨吸收。

依替膦酸二钠(羟乙膦酸钠)[保(乙)]

Etidronate Sodium

【适应证】(1) 高钙血症；(2) Paget病；(3) 骨质疏松症；(4) 甲状旁腺功能亢进。

【注意事项】(1) 肾功能减退者慎用。(2) 长期大剂量（一日 10 ~ 20 mg/kg）应用可引起骨矿化障碍，导致骨软化和骨折。(3) 进食及高钙食品可降低药物吸收率。(4) 体内钙和维生素D不足者用药后可引起低钙血症。(5) 有症状性食管反流症、裂孔疝者服药后易出现食管黏膜刺激症。

【禁忌证】中重度肾功能衰竭者、孕妇。

【不良反应】口服可出现恶心、腹泻；静脉注射过程中或注药后可引起短暂味觉改变或丧失；皮疹、瘙痒等过敏反应少见。

【用法与用量】高钙血症：一日 7.5 mg/kg 静脉滴注，共3日，若需重复则应间隔7日；血钙下降后可改为一日口服 20 mg/kg，服30日，最长不超过90日。

【制剂与规格】依替膦酸二钠片：200 mg。

依替膦酸二钠注射液：6 ml : 300 mg。

5.5.1.2 降钙素

降钙素可抑制破骨细胞的增殖，减少破骨细胞的数量和生存期，抑制骨吸收，降低骨转换；也是治疗各种高钙血症的药物之一。目前有鲑鱼降钙素和鳗鱼降钙素类似物，可皮下或肌内注射，前者还有鼻喷制剂。

主要不良反应为少数病人有脸红、恶心等，多数在用药过程中可自行消失。

鲑鱼降钙素

Salmon Calcitonin

【适应证】(1) 高钙血症；(2) Paget病；(3) 骨质疏松症；(4) 痛性骨病。

【注意事项】(1) 对蛋白质过敏者在用药前需做皮试。(2) 部分患者在用药中会出现抗体而对治疗产生抵抗性。(3) 鼻炎可加强鼻喷剂的吸收；鼻喷剂的全身不良反应少于针剂。

【禁忌证】孕妇和哺乳期妇女及儿童不宜使用。

【不良反应】常见颜面潮红，面部、耳、手或足刺痛，腹泻，恶心，呕吐，胃痛，注射部位红、肿、胀、痛；较少见尿频；极少见过敏反应、皮疹、寒战、头晕、头痛、胸闷、鼻塞、呼吸困难、血糖升高。

【用法与用量】(1) 肌内注射：50 ~ 100 U，每周 2 ~ 6 次不等。(2) 喷鼻：每日 100 ~ 400 U，分别喷两侧鼻孔。

【制剂与规格】鲑鱼降钙素注射液：① 1 ml : 200 U；② 1 ml : 100 U；③ 1 ml : 50 U。

鲑鱼降钙素鼻喷剂：①鼻喷剂 50（每揿 50 U）；②鼻喷剂 100（每揿 100 U）。

依降钙素

Elcatonin

将鳗鱼降钙素结构修改后的类似物，即[氨基辛二酸 1，7]- 鳗鱼降钙素，较鳗鱼降钙素的半衰期长，生物活性增强。

【适应证】【注意事项】【不良反应】参见鲑鱼降钙素。

【用法用量】高钙血症：一日 2 次，一次 40 U，肌内注射。

【制剂】依降钙素注射液：① 1ml : 10 U；② 1ml : 40 U。

5.5.2 甲状旁腺功能减退症及其药物治疗

甲状旁腺功能减退症（hypoparathyroidism）是由于甲状旁腺素（PTH）分泌过少而引起的一组临床症候群，表现为神经肌肉兴奋性增高、低钙血症、高磷血症与血清PTH减少。本症也可由于靶细胞对PTH反应缺陷所致，称为假性甲状旁腺功能减退症。

甲状旁腺功能减退症的治疗主要采用维生素D与补充钙剂使血清钙基本接近正常，血清磷下降、防止手足抽搐发作与异位钙化。

5.5.2.1 钙制剂

氯化钙[保(乙)]

Calcium Chloride

每1 g氯化钙含钙6.8 mmol(273 mg)。

【适应证】(1) 钙缺乏。(2) 维生素D缺乏。(3) 过敏性疾病。

【注意事项】【不良反应】见相关章节。

【用法与用量】低钙血症：氯化钙0.5～1 g（136～272 mg元素钙）稀释后静脉缓慢注射，每分钟不超过0.5～1 ml（13.6～27.2 mg钙），根据病人血钙水平，1～3日重复给药。也可用氯化钙稀释于氯化钠注射液或右旋糖酐内，每分钟滴注0.5～1 mg（最高每分钟2 mg）。

【制剂与规格】氯化钙注射液：① 10 ml：0.3 g；② 10 ml：0.5g；③ 20 ml：0.6 g；④ 20 ml：1g。

葡萄糖酸钙[基(基)，保(甲)]

Calcium Gluconate

每1 g葡萄糖酸钙含钙2.2 mmol (89 mg)。

【适应证】(1) 钙缺乏。(2) 维生素D缺乏。(3) 过敏性疾病。

【注意事项】【不良反应】见相关章节。

【用法与用量】低钙血症：成人，葡萄糖酸钙1 g静脉缓慢注射，每分钟不超过5 ml（1 ml：0.1 g钙）；小儿，200～400 mg静脉缓慢注射，每分钟不超过5 ml(1 ml：0.1 g钙)。根据病人血钙水平，需要时可重复给药。

【制剂与规格】葡萄糖酸钙注射液：10 ml：1 g。

葡萄糖酸钙片：0.1 g；0.5 g。

葡萄糖酸钙口服液：10 ml：1 g。

乳酸钙

Calcium Lactate

每1 g乳酸钙含钙4.58 mmol (184 mg)。

【适应证】(1) 钙缺乏。(2) 维生素D缺乏。(3) 过敏性疾病。

【注意事项】【不良反应】见相关章节。

【用法与用量】口服：低钙血症：成人，一次0.5～1 g，一日2～3次；小儿，一次0.3～0.6 g，一日2～3次；需同时服用维生素D。

【制剂与规格】乳酸钙片：0.3 g；0.5 g。

醋酸钙[保(乙)]

Calcii Acetate

【适应证】用于纠正高磷血症，也可用于钙的补充。

【注意事项】(1) 本品宜在空腹（饭前1小时）时服用。(2) 应尽量通过正常膳食保证钙的摄入。(3) 本品不宜大量长期服用，故不宜用于钙缺乏症的治疗。(4) 使用时间超过2周时，应进行血钙血磷的监测。(5) 肝肾功能不全时应在医嘱下使用。(6) 孕妇，哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】高钙血症者禁用。

【不良反应】可见嗳气，便秘，腹部不适，大剂量服用可见高钙血症：表现为厌食、恶心、呕吐、便秘、腹痛、肌无力、心律失常和骨石灰沉着等。

【用法与用量】口服，用于纠正高磷血症，应根据血磷检验数据，由医师决定。钙的补充一日最高限800 mg（以钙元素计，扣除饮食中的钙）。

【制剂与规格】醋酸钙片：0.667 g。

碳酸钙[保(乙)]

Calcium Carbonate

【适应证】(1) 钙缺乏；(2) 维生素D缺乏。

【注意事项】【不良反应】见相关章节。

【用法与用量】每日需要钙剂量（元素钙）：0～3岁，400～800 mg；4～6岁，800 mg；7～10岁，800 mg；成人，800～1 200 mg；孕妇，1 200 mg；哺乳期妇女，1 200 mg。口服：低钙血症：成人，一日2 g，分次服用；维生素D缺乏需同时服用维生素D。

【制剂与规格】碳酸钙片：0.5 g。

碳酸钙胶囊：1.5 g。

5.5.2.2 维生素D

活性维生素D制剂有1，25-$(OH)_2D_3$和1α-OH-D_3两种，后者可在肝脏转化为1，25-$(OH)_2D_3$。

骨化三醇[保(乙)]

Calcitriol

【适应证】(1) 钙缺乏。(2) 维生素D缺乏。(3) 甲状旁腺功能减退症。

【注意事项】【不良反应】见相关章节。

【用法与用量】口服：低钙血症，成人，一日0.25～0.5μg，分2次。

【制剂与规格】骨化三醇胶囊：① 0.25μg；② 0.5μg。

阿法骨化醇[保(乙)]

Alfacalcidol

【适应证】(1) 钙缺乏。(2) 维生素D缺乏。(3) 甲状旁腺功能减退症。

【注意事项】【不良反应】见相关章节。

【用法与用量】口服：低钙血症：成人，一日0.25～1.0μg，分2次。

【制剂与规格】阿法骨化醇胶囊：① 0.25μg；② 1μg。

阿法骨化醇片：① 0.25μg；② 0.5μg。

5.5.3 骨质疏松症及其药物治疗

骨质疏松症(osteoporosis)是以骨量减少、骨的微细结构破坏为特征，导致骨脆性增加，强度受损，骨折危险性增加的一种全身性代谢性骨骼疾病。骨质疏松症分为原发性、继发性和特发性3类，原发性骨质疏松症是由于绝经或者衰老引起的骨骼退行性变；继发性骨质疏松症是由于某些疾病、药物、营养和活动异常而造成的；特发性骨质疏松症原因不清，发生于青春发育前的儿童，而在青春期后可自行缓解。

骨质疏松症的预防和治疗策略的基础措施有：富含钙、低盐和适量蛋白质的均衡饮食；注意适当户外活动和规律运动；避免嗜烟、酗酒和慎用影响骨代谢的药物等；积极采取防止跌倒的各种措施。

目前骨质疏松症的治疗药物主要有两大类，一类为骨吸收抑制药，如钙剂、降钙素、双膦酸盐、维生素D及其衍生物、雌激素和选择性雌激素受体调节药；另一类为骨形成促进剂，如氟化物、合成类固醇、甲状旁腺激素和维生素D及其衍生物，后者具有抑制骨吸收和促进骨形成的双相作用。

钙剂 补充钙剂可轻度增加骨密度，预防骨量丢失。

维生素D制剂 维生素D制剂可升高骨密度，降低椎体骨折的危险性，活性维生素D的作用强于普通维生素D。

阿仑膦酸钠[保(乙)]

Alendronate Sodium

是新一代双膦酸盐，有强的抑制骨吸收作用，使骨密度明显增加，不影响骨矿化，明显减少骨折的危险性。

【适应证】同羟乙膦酸钠。

【注意事项】(1) 轻、中度肾功能减退者慎用。(2) 有消化不良、吞咽困难、上消化道疾病的妇女慎用。(3) 孕妇不宜使用。(4) 需严格按给药说明口服。

【禁忌证】有食管动力障碍，如食管弛缓不能、食管狭窄者禁用。

【不良反应】腹痛、腹泻、恶心、便秘、消化不良、不遵守服药方法者可有食管溃疡；无症状性血钙降低、短暂血白细胞升高、尿红细胞、白细胞升高。

【用法与用量】骨质疏松症：一日10mg口服；或70mg口服，一周1次。

【制剂与规格】阿伦膦酸钠片：① 10mg；② 70mg。

利塞膦酸钠[保(乙)]

Risedronate Sodium

【适应证】用于治疗和预防绝经后妇女的骨质疏松症。

【注意事项】(1) 服药后2小时内，避免食用高钙食品(如牛奶或奶制品)及服用补钙剂或含铝、镁等的抗酸药物。(2)不宜与阿司匹林或非甾体抗炎药同服。(3) 重度肾功能损害者慎用本品。(4) 饮食中钙、维生素D摄入不足者，应加服这些药品。(5) 勿嚼碎或吸吮本品。(6) 孕妇用药的安全有效性尚未确立，除非疾病本身对母子的危害性更大并无其他更安全药物替代时，才在妊娠期使用本品。本品

对哺乳婴儿有严重的不良反应，哺乳期妇女应停药或停止哺乳。临床试验资料表明，老年人和年轻人在服用本品时无安全性和有效性上的差异，但不排除老年人个体对本品具有高敏性。

【禁忌证】以下患者禁用：①已知对本品过敏者；②低钙血症患者；③ 30 分钟内难以坚持站立或端坐位者。

【不良反应】(1) 消化系统：可引起上消化道紊乱，表现为吞咽困难、食管炎、食管或胃溃疡，还可引起腹泻、腹痛、恶心、便秘等。(2) 其他，如流感样综合征、头痛、头晕、皮疹、关节痛等。

【用法与用量】口服：一次 5 mg，一日 1 次，需至少餐前 30 分钟直立位服用，以 200 ml 左右清水送服，服药后 30 分钟内不宜卧床。

【制剂与规格】利塞膦酸钠片：5 mg。

利塞膦酸钠胶囊：5 mg。

氯曲膦酸钠（氯膦酸二钠）[保(乙)]

Disodium Clodronate Sodium

【适应证】用于治疗恶性肿瘤引起的高钙血症及骨质溶解。

【注意事项】(1) 本品主要经肾脏清除，因此，在治疗过程中一定要维持足够的水分摄入。应整粒吞服。(2) 任何情况下不能将氯膦酸盐与含有钙或其他二价阳离子的牛奶、食物或药物同服，因为它们会减少氯膦酸盐的吸收。(3) 不得与其他二膦酸盐同时使用。(4) 妊娠期、哺乳期妇女及儿童慎用。

【禁忌证】禁用于已知对二磷酸盐过敏的患者，严重肾功能不全者禁用。

【不良反应】常见恶心，呕吐和腹泻，AST、ALT 升高，无症状的低钙血症。罕见有症状的低钙血症、血清甲状旁腺素水平升高、肾功能损害。

【用法与用量】口服：日剂量 1 600 mg，建议单次用药。若日剂量高于 1 600 mg，超过的部分建议分次给药（作为第二剂量），具体如下：单次日剂量或两次用药的首剂量最好于早晨空腹以一杯水送服。在随后的 1 小时内，患者应禁止进食、饮水（白水除外）及口服其他任何药物。如果一日 2 次用药，应按上述方法服用第一个剂量。第二个剂量应在两餐间服用，时间应安排在进食、饮水（白水除外）或口服其他任何药物 2 小时后、1 小时前。肾功能正常的成年患者：恶性肿瘤所致的高钙血症的治疗，起始剂量应采用高剂量，即一日 2 400 mg 或 3 200 mg，依据个体的治疗情况，逐渐减至一日 1 600 mg 以维持正常的血清钙水平；恶性肿瘤所致的骨质溶解的治疗，口服治疗不伴有高钙血症的骨吸收增加时，剂量应个体化，推荐起始剂量为一日 1 600 mg，如果临床需要，可增加剂量，但建议单日剂量不要超过 3 200 mg。肾衰竭患者应谨慎，不应连续使用 1 600 mg 以上的日剂量。

【制剂与规格】氯曲膦酸钠胶囊：400 mg。

帕米膦酸二钠[保(乙)]

Pamidronate Disodium

【适应证】用于恶性肿瘤并发的高钙血症和溶骨性癌转移引起的骨痛。

【注意事项】(1) 本品需以不含钙的液体稀释后立即静脉缓慢滴注，不可将本品直接静脉滴注。(2) 本品不得与其他种类双膦酸类药物合并使用。(3) 动物实验中使用本品曾发生肾毒性，肾功能损伤者慎用。(4) 用于治疗高钙血症时，应同时注意补充液体，使每日尿量达 2 L 以上。使用本品过程中，应注意监测血清钙、磷等电解质水平。(5) 老年患者用药适当减量；儿童一般不用，可能影响骨骼成长；孕妇应权衡利弊用药，药物可进入母乳中，故哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品和双膦酸盐有过敏史者禁用。

【不良反应】少见轻度恶心、胸痛、胸闷、头晕、乏力及轻微肝肾功能改变等；偶见发热。

【用法与用量】(1) 治疗骨转移性疼痛：一次 30 ~ 60 mg，用前稀释于不含钙离子的氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液中，缓慢静脉滴注 4 小时以上，浓度不得超过 15 mg/125 ml，滴速不得 > 15~30 mg/2 小时。(2) 治疗高钙血症：应严格按照血浆钙浓度，在医生指导下酌情用药。一般参考见表 5-2。

表 5-2 帕米膦酸二钠治疗高钙血症用药参考

血钙浓度（mmol/L）	＜3.0	3.0 ~ 3.5	3.5 ~ 4.0	＞4.0
血钙浓度（mg%）	＜12.0	12.0 ~ 14.0	14.0 ~ 16.0	＞16.0
本品剂量（mg）	15 ~ 30	30 ~ 60	60 ~ 90	90

【制剂与规格】帕米膦酸二钠注射液：5 ml ∶ 15 mg（以无水物计）。

唑来膦酸[保（乙）]

Zoledronic Acid

【适应证】用于恶性肿瘤溶骨性骨转移引起的骨痛。

【注意事项】(1) 首次使用本品时应密切监测血清中钙、磷、镁及血清肌酸酐的水平，如出现血清中钙、磷和镁的含量过低，应给予必要的补充治疗。(2) 伴有恶性高钙血症患者给予本品前应充分补水，利尿药与本品合用时只能在充分补水后使用，本品与具有肾毒性的药物合用时应慎重。(3) 接受本品治疗时，如出现肾功能恶化，应停药至肾功能恢复到基线水平。(4) 对阿司匹林过敏的哮喘患者应慎用本品。(5) 儿童用药：对本品在儿童中使用的安全性及有效性尚未确立，暂不推荐使用。(6) 老年患者用药同成人，但老年患者往往肾功能较低下，给药时应密切监测肾功能状况。

【禁忌证】对本品及其他双膦酸类药物过敏的患者禁用。严重肾功能不全者不推荐使用。孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】本品的不良反应多为轻度和一过性的，大多数情况下无需特殊处理会在 24 ~ 48 小时自动消退。常见的不良反应是发热。其他不良反应主要包括：①全身反应，乏力、胸痛、腿水肿、结膜炎；②消化系统，恶心、呕吐、便秘、腹泻、腹痛、吞咽困难、厌食；③心血管系统，低血压；④血液和淋巴系统，贫血、低钾血症、低镁血症、低磷血症、低钙血症、粒细胞减少、血小板减少、全血细胞减少；⑤肌肉与骨骼，骨痛、关节痛、肌肉痛；肾脏：血清中肌酸酐值升高（与给药的时间有关）；⑥神经系统，失眠、焦虑、兴奋、头痛、嗜睡；⑦呼吸系统，呼吸困难、咳嗽、胸腔积液；⑧感染，泌尿道感染、上呼吸道感染；⑨代谢系统，厌食、体重下降、脱水；⑩其他，流感样症状、注射部位出现红肿、皮疹、瘙痒等。

【用法与用量】静脉滴注：成人一次 4 mg，用 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 100 ml 稀释后静脉滴注，滴注时间应不少于 15 分钟，每 3 ~ 4 周给药 1 次或遵医嘱。

【制剂与规格】注射用唑来膦酸 4 mg（以无水唑来膦酸计）。

唑来膦酸注射液：① 1 ml ∶ 1 mg（以无水唑来膦酸注射液计）；② 5 ml ∶ 4 mg。

雷奈酸锶[保（乙）]

Strontium Ranelate

【适应证】治疗绝经后骨质疏松症以降低椎体和髋部骨折的危险性。

【注意事项】(1) 不建议本品用于肌酐清除率＜每分钟 30 ml 的患者。(2) 具有高静脉血栓 (VTE) 危险性的患者包括有 VTE 既往史的患者，应当谨慎使用本品。(3) 在本品使用中报道有严重的超敏反应综合征，特别是伴有嗜酸粒细胞增多和全身症状的药物疹 (DRESS)，偶有致命性。DRESS 综合征典型表现为：皮疹、发热、嗜酸粒细胞增多和全身症状（如腺体疾病、肝炎、间质性肾炎、间质性肺病）。发病时间一般为 3 ~ 6 周，大多数情况下停止使用本品和开始皮质激素治疗后结果良好，但恢复缓慢，已有报道，一些病例在停止皮质激素治疗后症状复发。(4) 当出现皮疹时应立即停止使用本品并告知医师。因出现过敏反应而停药的患者不应再使用本品。(5) 本品仅用于绝经后妇女。如果本品在妊娠期无意中服用，必须立即停药。锶可以排泄到乳汁中，哺乳期妇女不应当使用。不建议儿童和青少年使用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】可见恶心、腹泻、腹痛、口腔炎、头痛、皮炎、湿疹、肌肉痉挛、肌痛、关节痛、骨痛及肌酸激酶短暂性急

性升高。

【用法与用量】推荐剂量：口服，一日 1 次，1 次 2 g。需长期使用。食物、牛奶和牛奶制品能够降低雷奈酸锶的吸收，本品应当在两餐之间服用。因为吸收较慢，本品应当在睡前服用，最好在进食 2 小时之后。使用雷奈酸锶治疗的患者，如果饮食摄入不足，应当补充维生素 D 和钙。

【制剂与规格】雷奈酸锶干混悬剂：2 g。

降钙素[保(乙)] 能有效抑制破骨细胞的骨吸收作用，减少破骨细胞的数量，增加骨密度，明显减少椎体骨折的危险性并具有良好的止痛作用，用于骨质疏松症的防治。(其他见 5.5.1.2)

雷洛昔芬[保(乙)] (Raloxifene) 是选择性雌激素受体调节药，在骨骼具有雌激素样作用，在子宫和乳腺表现为拮抗作用。对于已停经妇女，在骨骼及调节血脂方面产生与雌激素类似作用。能改善骨骼及调节血脂，降低心血管事件的发生，不良反应：少数患者有潮热，腿肌肉痉挛和深静脉血栓。对椎体压缩明显的亚组观察到有降低椎体外骨折的危险性。其临床研究观察时间较短，有待进一步开展长期的临床试验。每日 60 mg，口服。

雌激素 雌激素缺乏被认为是绝经后骨质疏松症的主要原因，专家曾推荐激素替代治疗（HRT）为预防绝经后妇女骨量丢失的一线药物，但其利弊还需进一步深入研究。HRT 的使用应在专科医师的指导下，进行个体化的利弊权衡，若无禁忌证，并取得本人的知情同意后再开始应用，推荐低剂量（1/2 剂量）。用药期间应进行规范的随诊监测，酌情做必要的调整，以求最大限度的受益，避免不良反应。其他参见妇产科用药相关章节。

第 6 章 血液系统疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 缺铁性贫血
- 巨幼细胞贫血
- 白细胞减少症
- 特发性血小板减少性紫癜
- 止血与凝血异常性疾病
- 白血病

6.1 贫血及其药物治疗

6.1.1 缺铁性贫血的药物治疗

铁（iron）是人体不可缺少的元素，是构成血红蛋白、肌红蛋白及多种酶的重要成分。一般情况下，人体不会缺铁，只有育龄妇女及生长发育时期儿童、铁的需要量增加而铁供应不足、胃及十二指肠疾病影响铁的吸收及长期小量失血后，才会出现铁缺乏或缺铁性贫血，需要给铁剂补充治疗。常用的铁剂为硫酸亚铁、富马酸亚铁、琥珀酸亚铁等。近年来，各种复合铁，如多糖铁复合物及有机铁制剂亦开始在临床应用。铁剂的选择以口服制剂为首选，亚铁制剂因铁吸收较高为首选。

铁剂适用于预防或治疗各种原因引起的缺铁，包括儿童或婴儿期需铁量增加而食物中供应量不足、铁吸收障碍、妊娠中后期及慢性失血等。

铁剂应用注意事项如下。

（1）下列情况慎用：①乙醇中毒；②肝炎；③急性感染；④肠道炎症如肠炎、结肠炎、憩室炎及溃疡性结肠炎；⑤胰腺炎；⑥消化性溃疡。

（2）注射铁剂期间，不宜同时口服铁，以免发生毒性反应。

（3）妊娠期补充铁剂以在妊娠中、后期最为适当，由于此时铁摄入量减少而需要量增加；治疗剂量铁对胎儿和哺乳的不良反应未见报道，因为老年患者胃液分泌减少、自肠黏膜吸收减少，可适当增加口服铁剂剂量，避免婴儿肌内注射铁剂。

（4）对诊断的干扰：应用铁剂后，血清铁蛋白增高，大便隐血试验阳性。

（5）用药期间需定期做下列检查，以观察治疗反应：①血红蛋白测定；②网织红细胞计数；③血清铁蛋白及血清铁测定。

（6）药物过量发生的急性中毒多见于儿童，由于坏死性胃炎或肠炎，患者可有严重呕吐、腹泻及腹痛，以致血压降低、代谢性酸中毒，甚至昏迷。24 ~ 48 小时后，严重中毒可进一步发展至休克及血容量不足、肝损害及心力衰竭。患者可有全身抽搐。中毒后期症状有皮肤湿冷、发绀、嗜

睡、极度疲乏及虚弱、心动过速。有急性中毒征象应立即用去铁胺救治。

铁剂药物相互作用：①口服铁剂与抗酸药如碳酸氢钠、磷酸盐类及含鞣酸的药物或饮料同用，易产生沉淀而影响吸收。②本品与西咪替丁、去铁胺、二巯丙醇、胰酶、胰脂肪酶等同用，可影响铁的吸收；与铁剂合用，可影响四环素类药、氟喹诺酮类、青霉胺及锌剂的吸收。③与维生素 C 同服，可增加本品吸收，但也易致胃肠道反应。

铁剂禁忌证：①血色病或含铁血黄素沉着症及不伴缺铁的其他贫血（如珠蛋白生成障碍性贫血）。②肝、肾功能严重损害，尤其伴有未经治疗的尿路感染者不宜注射铁剂。

铁剂的不良反应有：①口服铁剂均有收敛性，服后有轻度恶心、胃部或腹部疼痛，轻度腹泻或便秘也很常见，多与剂量及品种有关，硫酸亚铁反应最明显。②口服糖浆铁制剂后容易使牙齿变黑。缓释剂型可明显减轻胃肠道反应。③肌内注射铁剂反应较多。右旋糖酐铁注射后，除注射部位局部疼痛或色素沉着、皮肤瘙痒外，全身反应轻者有面部潮红、头痛、头晕；重者有肌肉及关节酸痛、恶心、呕吐、眩晕、寒战及发热；更严重者有呼吸困难、气促、胸前压迫感、心动过速、低血压、心脏停搏、大量出汗以至过敏性休克，幼儿常可致死亡。

铁剂给药说明如下。

(1) 注射铁剂临床应用于以下几种情况：①口服铁剂后胃肠道反应严重而不能耐受者；②口服铁剂而不能奏效者，如脂肪泻、萎缩性胃炎等有胃肠道铁吸收障碍者，及胃大部切除术后；③需要迅速纠正缺铁，如妊娠后期严重贫血者；④严重消化道疾患，口服铁剂可能加强原发病者，如溃疡性结肠炎或局限性肠炎；⑤不易控制的慢性出血，失铁量超过肠道所能吸收的铁量；⑥肌内注射铁剂在注射完总量后就应停用。

(2) 口服铁剂有轻度胃肠反应，重者于餐后服用，但对药物吸收有所影响。

(3) 缺铁患者补充铁剂，在血红蛋白恢复正常后，仍需继续服 3 ~ 6 个月，以补充缺失的储存铁量。如有条件进行铁蛋白测定，可在血清铁蛋白上升到 30 ~ 50 μg/L 后停药。

硫酸亚铁[基(基)，保(甲)]

Ferrous Sulfate

【适应证】用于各种原因（如慢性失血、营养不良、妊娠、儿童发育期等）引起的缺铁性贫血的治疗及预防。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 一般使用口服铁剂，仅在少数完全不能耐受口服铁剂或不能吸收时才采用注射给药。(3) 应用铁剂治疗期间，大便颜色发黑，大便潜血试验阳性，应注意与上消化道出血相鉴别。(4) 治疗剂量不得长期使用，应在医师确诊为缺铁性贫血后使用，且治疗期间应定期检查血象和血清铁水平。(5) 酒精中毒、肝炎、急性感染、肠道炎症、胰腺炎等患者慎用；胃与十二指肠溃疡、溃疡性肠炎患者慎用。(6) 本品不应与浓茶同服；宜在餐后或餐时服用，以减轻胃部刺激。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者禁用。(2) 肝、肾功能严重损害，尤其是伴有未经治疗的尿路感染者禁用。(3) 铁负荷过高、血色病或含铁血黄素沉着症患者禁用。(4) 非缺铁性贫血（如珠蛋白生成障碍性贫血）患者禁用。

【不良反应】(1) 可见胃肠道不良反应，如恶心、呕吐、上腹疼痛、便秘。(2) 本品可减少肠蠕动，引起便秘，并排黑粪。

【用法与用量】口服：(1) 硫酸亚铁片：①成人。预防量为一次 0.3 g，一日 1 次，餐后服用；治疗量，一次 0.3 g，一日 3 次。②儿童。预防量，一日 5 mg/kg；治疗量，1 岁以下，一次 60 mg，一日 3 次；1 ~ 5 岁，一次 120 mg，一日 3 次；6 ~ 12 岁，一次 0.3 g，一日 2 次。(2) 2.5% 硫酸亚铁糖浆：儿童一日 0.6 ~ 1.2 ml/kg。(3) 硫酸亚铁缓释片：一次 0.45g，一日 1 次。

【制剂与规格】硫酸亚铁片：0.3 g。

硫酸亚铁糖浆：4%。

硫酸亚铁缓释片：0.45 g。

富马酸亚铁[保(乙)]

Ferrous Fumarate

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见硫酸亚铁。

【用法与用量】口服：①成人，预防量为0.2 g，一日1次；治疗量，一次0.2～0.4 g，一日3次。②儿童常用量，1岁以下，一次35 mg，一日3次；1～5岁，一次70 mg，一日3次；6～12岁，一次140 mg，一日3次。

【制剂与规格】富马酸亚铁片：0.2 g。

富马酸亚铁咀嚼片：① 50 mg；② 200 mg。

富马酸亚铁胶囊：0.2 g。

葡萄糖酸亚铁[保(乙)]

Ferrous Gluconate

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见硫酸亚铁。

【用法与用量】口服：①成人，治疗量，一次0.3～0.6 g，一日3次；预防量，一次0.3 g，一日1次。②儿童为一日30 mg/kg，分3次服用。

【制剂与规格】葡萄糖酸亚铁片：① 0.1 g；② 0.3 g。

葡萄糖酸亚铁糖浆：① 10 ml：0.25g；② 10 ml：0.3 g。

葡萄糖酸亚铁胶囊：① 0.25 g；② 0.3 g；③ 0.4 g。

琥珀酸亚铁[保(乙)]

Ferrous Succinate

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见硫酸亚铁。

【用法与用量】口服：①成人，治疗量，一次0.1～0.2 g，一日3次，餐后服用。预防量，一次0.1 g～0.2 g，一日1次。②儿童，一日6～18 mg/kg，分3次服用。

【制剂与规格】琥珀酸亚铁片：0.1 g。

琥珀酸亚铁胶囊：0.1 g。

山梨醇铁[保(乙)]

Iron Sorbitex

【适应证】一般不做首选铁剂。主要用于预防和治疗各种不宜口服铁剂者，如溃疡性结肠炎；或口服治疗无效的缺铁性贫血；或者是需要迅速纠正贫血状况者。

【注意事项】(1) 需深部肌内注射，进针及出针速度要快，以免药液渗出至皮下。(2) 不宜同时口服铁剂，以免发生毒性反应。(3) 注射本品后，血红蛋白未见逐渐升高应立即停药。(4) 本制剂不能静脉注射。

【禁忌证】血色病或含铁血黄素沉着症、溶血性贫血、已知对铁过敏者及肝肾功能损害者禁用。

【不良反应】注射后有金属味及注射局部疼痛；少数患者可有发热、心动过速及关节痛等变态反应；有报道，个别患者因肌内注射本品出现过敏性休克和（或）心脏毒性而死亡。

【用法与用量】深部肌内注射：(1) 成人一次25～50 mg，隔1～3日1次。(2) 儿童：体重＞6 kg，一次25 mg，一日1次；体重＜6 kg，一次12.5 mg，一日1次。贫血纠正后应继续使用一段时间以补充储存铁。

【制剂与规格】山梨醇铁注射液：2 ml：50 mg (Fe)。

多糖铁复合物

Iron Polysaccharide Complex

【适应证】用于治疗单纯性缺铁性贫血。

【注意事项】对于治疗孕产妇缺铁性贫血，其优越性尤为突出。本品以完整的分子形式存在，在消化道中能以分子形式被吸收，其吸收率不低于硫酸亚铁，且不受胃酸减少、食物成分的影响，有极高的生物利用度。婴儿补铁过量时，多数新生儿易发生大肠埃希菌感染。

【禁忌证】见硫酸亚铁。

【不良反应】罕见恶心、呕吐、胃肠刺激或便秘。

【用法与用量】口服：成人，一次150～300 mg，一日1次；儿童需在医生的指导下使用。

【制剂与规格】多糖铁复合物胶囊：含铁元素150 mg。

右旋糖酐铁[基(基)，保(甲)]

Iron Dextran

【适应证】用于不能口服铁剂或口服

铁剂治疗不满意的缺铁患者。

【注意事项】(1) 注射本品后血红蛋白未见逐步升高者应即停药。(2) 婴儿尽量避免肌内注射。(3) 任何右旋糖酐铁的肠道外给药都可能引起致命性的过敏反应。对药物有过敏史的患者危险性增加。右旋糖酐铁只能在具备抢救条件的情况下给药。(4) 给有自身免疫性疾病或有炎症的患者用药，可能会引起Ⅲ型变态反应。(5) 静脉注射过快可能引起低血压。(6) 肠道外途径给予铁剂可能引起过敏或中毒反应。对有感染的儿童可能会产生不利影响。(7) 有动物和人体的资料显示，在同一部位反复肌内注射可出现肉瘤。(8) 血浆铁蛋白在静注后 7 ~ 9 日达到峰浓度，而在 3 周后又缓慢地回到基线。(9) 测定骨髓的铁储备在右旋糖酐铁治疗的延长期没有意义，因为残留的右旋糖酐铁可能滞留于网状内皮细胞。

【禁忌证】(1) 不能用于妊娠初始 3 个月内的妇女，严重肝、肾功能不全者禁用。(2) 非缺铁性贫血（如溶血性贫血）。(3) 铁超负荷或铁利用紊乱。(4) 已知对铁单糖或双糖的过度敏感。(5) 代偿失调的肝硬化、传染性肝炎、急慢性感染的患者。(6) 哮喘、湿疹或其他特应性变态反应患者。

【不良反应】(1) 本品注射后，可产生局部疼痛及色素沉着。(2) 急性过敏反应表现为呼吸困难、潮红、胸痛和低血压，发生率约 0.7%。缓慢静脉注射可降低急性严重反应。过敏反应一般出现在给予试验剂量时间内。(3) 最常见的不良反应是皮肤瘙痒（1.5%），呼吸困难（1.5%）。其他不良反应有胸痛（1.0%），恶心（0.5%），低血压（0.5%），淋巴结肿大（0.5%），消化不良（0.5%），腹泻（0.5%），潮红（0.3%），头痛（0.3%），心脏停搏（0.2%），关节肌肉疼痛（0.2%）等。(4) 偶有注射部位的静脉疼痛和感染的报道。

【用法与用量】肌内、静脉注射或静脉滴注：一日 100 ~ 200 mg 铁，根据补铁总量确定，一周 2 ~ 3 次。(1) 试验剂量：右旋糖酐铁的主要不良反应为过敏反应，可在给药后的几分钟内发生。因此建议在给予患者初次剂量前先给予 0.5 ml 右旋糖酐铁（相当于 25 mg 铁），如 60 分钟后无不良反应发生，再给予剩余的剂量。(2) 深部肌内注射：一次 50 ~ 100 mg（铁元素），1 ~ 3 日 1 次。儿童体重超过 6 kg 者一次 50 mg（铁元素），一日 1 次。(3) 静脉滴注：100 ~ 200 mg 右旋糖酐铁用 0.9% 氯化钠溶液或 5% 葡萄糖溶液稀释至 100 ml。给予首次剂量时，应先缓慢滴注 25 mg 至少 15 分钟，如无不良反应发生，可将剩余剂量在 30 分钟内滴注完毕。(4) 静脉注射：将相当于 100 ~ 200 mg 铁（2 ~ 4 ml）的右旋糖酐铁用 0.9% 氯化钠溶液或 5% 葡萄糖溶液 10 ~ 20 ml 稀释后缓慢静脉注射，同样在初次给药时先缓慢注射 25 mg（1 ~ 2 分钟），如无不良反应发生，再给予剩余的剂量（每分钟 0.2 ml）。肌内注射不需要稀释。总补铁剂量约 20 mg/kg 右旋糖酐铁也可采用一次性滴注给药的方法。此法应将所给剂量稀释至 0.9% 氯化钠溶液或 5% 葡萄糖溶液 250 ~ 1 000 ml 中，并静脉滴注 4 ~ 6 小时。

【制剂与规格】右旋糖酐铁注射液：① 2 ml：50 mg（铁元素）；② 2 ml：100 mg（铁元素）。

蔗糖铁 [保（乙）]

Iron Sucrose

【适应证】见右旋糖酐铁。

【注意事项】特别注意有支气管哮喘、有过敏史患者用药时发生过敏反应。慎用于急慢性感染、总铁结合力低和（或）叶酸缺乏的患者。

【禁忌证】非缺铁性贫血、铁过量或铁利用障碍、已知对单糖或二糖铁复合物过敏者。妊娠初始 3 个月内禁用。

【不良反应】偶可出现金属味、头痛、低血压；极少见胃肠功能障碍，发热、肌肉痛等。罕见过敏反应。

【用法与用量】以滴注或缓慢注射的方式静脉给药，或直接注射到透析器的静脉端。(1) 首次用药进行测试，成人用 1 ~ 2.5 ml（20 ~ 50 mg 铁元素），体重 > 14 kg 的儿童用 1 ml（20 mg 铁元素），体重 < 14 kg 的儿童用日剂量的一

半（1.5 mg/kg）。应备有心肺复苏设备。如果在给药15分钟后未出现任何不良反应，继续给予余下的药液。(2) 静脉滴注：只能用氯化钠注射液稀释，不超过20倍，滴注速度为：100 mg铁元素滴注至少15分钟；200 mg至少滴注30分钟；300 mg滴注1.5小时；400 mg滴注2.5小时；500 mg滴注3.5小时。(3) 静脉注射：不用稀释，缓慢注射。速度为每分钟1 ml本品(5 ml本品至少注射5分钟)，一次最大注射剂量是10 ml本品（200 mg铁元素）。静脉注射后应伸展患者的胳膊。(4) 直接注射到透析器的静脉端：不用稀释，注射情况同“静脉注射”。常用剂量：①成年人和老年人，根据血红蛋白水平，一次5～10 ml（100～200 mg铁元素），一周2~3次；②儿童，根据血红蛋白水平，一次0.15 ml/kg本品(＝3 mg/kg)，一周2～3次。(5) 用量计算：①总缺铁量(mg)＝体重（kg）×（Hb目标值－Hb实际值）(g/L) ×0.24+储存铁量(mg)，体重≤35 kg，Hb目标值=130 g/L，储存铁量=15 mg/kg体重；体重＞35 kg，Hb目标值=150 g/L，储存铁量＝500 mg；其中，因子0.24=0.003 4×0.07×1 000。转换成本药总量(ml)＝所需铁总量(mg) ÷20 mg/ml。②失血和支持自体捐血患者用量计算。补充铁量(mg)＝失血的单位数×200，需要本品量（ml）＝失血的单位数×10。如果已知失血量，静脉给予200 mg铁可使Hb升高相当1单位血（1单位血=400 ml，含Hb 150 g/L的血）。

【制剂与规格】蔗糖铁注射液：5 ml：100 mg（铁元素）。

6.1.2 铁负荷过多的药物治疗

铁负荷过多往往发生于长期多次输血者，如重症珠蛋白生成障碍性贫血患者，临床用去铁胺治疗。

去铁胺[保(甲)]

Deferoxamine

【适应证】用于铁负荷过多（血色病，含铁血黄素沉着症）；急性铁中毒；铝负荷过多。

【注意事项】(1) 长期应用过程中应定期检查铁蛋白、肝肾功能、视力和听力。(2) 儿童每年测体重及身高。(3) 妊娠期妇女慎用。(4) 铁负荷过重者使用去铁胺易发生感染，等待感染控制后再用药。(5) 铁负荷过重儿童或大量摄入去铁胺可造成生长发育迟缓，3岁以下儿童用药前监测生长发育指标，一日剂量不超过40 mg/kg。(6)口服本品后仍需注射给药，但静脉注射速度应缓慢。由于吸收速度快，肌内注射也可引起虚脱，注意剂量不应超过推荐剂量。(7) 用药后出现头晕或其他中枢神经障碍，视力／听力损害患者禁止驾驶车辆和操作机械。

【禁忌证】对去铁胺过敏者。无尿或严重肾功能不全者禁用。

【不良反应】(1) 局部反应，如肌内注射部位疼痛、肿胀和局部烧灼。(2) 全身反应，如口服会出现胃肠道症状（恶心、呕吐、腹痛和腹泻）；可出现过敏、水肿、关节痛、肌肉痛、头痛、头晕、荨麻疹及发热等全身反应；呼吸系统表现呼吸困难、哮喘、发绀和间质性肺炎；长期用药可有视力或听力障碍；少数患者出现神经系统障碍、耳鸣、听力丧失、头晕、肾功能损伤；少见粒细胞减少或缺乏；罕见生长迟缓。如静脉注射速度过快可致心动过速、低血压等。

【用法与用量】(1) 慢性铁负荷过重：当输血10～15次后或血清铁蛋白（SF）达1 000 μg/L时使用本品，开始一日0.5 g，一日监测24小时尿铁排出量，增加剂量到铁排出量达到平台为止，平均日剂量20～60 mg/kg；SF低于2 000 μg/L时日剂量25 mg/kg；介于2 000～3 000 μg/L时日剂量35 mg/kg；除个别成人需强化治疗外，一般日剂量不超过50 mg/kg。皮下注射比肌内注射更有效，以手提泵做缓慢皮下输注最方便，缓慢皮下输注8～12小时，如同剂量输注24小时可进一步增加排铁量。静脉输注较皮下注射更有效，对于不能连续皮下输注和铁负荷过重导致心功能异常的患者采用静脉滴注。(2) 急性铁中毒：在洗胃后将本品5～10 g溶于50～100 ml水中从胃管灌入结合未吸收的铁。为了清除已经吸收的铁，最好参

照血清铁浓度和总铁结合率，在下列情况下静脉输注或肌内注射：①血清铁高于5 000 μg/L者。②血清铁高于3 500 μg/L且血清中含游离铁者。③血清铁水平不详，但有急性铁中毒症状与体征者。④如患者血压正常，可一次肌内注射去铁胺成人2 g，儿童1 g。如患者低血压或发生休克，宜用静脉输注，最大输注速度不超过每小时15 mg/kg。通常在4～6小时后开始减量，24小时总量不超过80 mg/kg。

【制剂与规格】甲磺酸去铁胺片：0.1 g。

注射用甲磺酸去铁胺：0.5 g。

6.1.3 巨幼细胞贫血的药物治疗

多数巨幼细胞贫血（megaloblastic anemia）是由于缺乏维生素B_{12}或叶酸引起。治疗前应确定患者缺乏两者中何种物质及其程度后再行治疗。如因维生素B_{12}缺乏引起的贫血，只能用维生素B_{12}，或维生素B_{12}和叶酸的联合用药，不能单独用叶酸，否则会加重神经系统症状。

在病情较重时，为了不延误治疗，在得到骨髓象和血象结果后即可给予维生素B_{12}和叶酸治疗，通常在得到检验结果后制定治疗计划。诊断须除外白血病等。

如缺乏内因子或其他影响维生素B_{12}吸收不良时需肌内注射给药。因为多数维生素B_{12}与叶酸缺乏症经短期治疗即可，所以很少长期使用药物治疗。

叶酸[基(基)，保(甲/乙)]

Folic Acid

【适应证】各种原因引起的叶酸缺乏及由叶酸缺乏所致的巨幼细胞贫血；小剂量用于妊娠期妇女预防胎儿神经管畸形。

【注意事项】(1) 诊断明确后再用药。若为试验性治疗，应口服生理剂量，一日0.5 mg。(2) 恶性贫血及只有维生素B_{12}缺乏者不能单独用叶酸治疗。(3) 叶酸一般不用维持治疗，除非是吸收不良的患者。

【禁忌证】非叶酸缺乏的贫血或诊断不明的贫血，对叶酸及其代谢物过敏者。

【不良反应】偶见过敏反应。长期用药可出现畏食、恶心、腹胀等胃肠症状。大量服用时，可使尿呈黄色。

【用法与用量】口服：成人治疗量，一次5～10 mg，一日3次，直至血象恢复正常；小儿可酌情给予一日5～15 mg。预防量，一次0.4 mg，一日1次。

【制剂与规格】叶酸片：① 5 mg；② 0.4 mg。

亚叶酸钙[保(乙)]

Calicum Folinate

【适应证】叶酸拮抗药（如甲氨蝶呤）的解毒药；各种原因引起的叶酸缺乏，由叶酸缺乏所致的巨幼细胞贫血；当口服叶酸治疗效果不佳时。

【注意事项】(1) 应用本品解救叶酸拮抗药时应进行有关的实验室监测。(2) 根据甲氨蝶呤浓度调节其剂量。

【禁忌证】不宜单独用于维生素B_{12}缺乏的巨幼细胞贫血或诊断不明的贫血者。

【不良反应】偶见皮疹、荨麻疹或哮喘等过敏反应。

【用法与用量】(1) 口服：作为抗叶酸药（甲氨蝶呤）的解救药。首剂5～15 mg，6～8小时1次，连续2日，根据甲氨蝶呤浓度调节剂量。(2) 肌内注射：作为抗叶酸药（甲氨蝶呤）的解救药。在停用甲氨蝶呤后，6～15 mg/m^2，每6～8小时1次，直到甲氨蝶呤浓度在5×10^{-8} mol/L以下，一般需持续2日。用于叶酸缺乏所致的巨幼细胞贫血口服效果不佳者，每日肌内注射1 mg。

【制剂与规格】亚叶酸钙片：① 5 mg；② 10 mg；③ 15 mg。

亚叶酸钙注射液：① 1 ml : 3 mg；② 1 ml : 5 mg；③ 1 ml : 100 mg。

注射用亚叶酸钙：① 3 mg；② 5 mg；③ 25 mg；④ 30 mg；⑤ 50 mg；⑥ 100 mg。

维生素B_{12}[基(基)，保(甲)]

Vitamin B_{12}

【适应证】(1) 维生素B_{12}缺乏所致的巨幼细胞贫血。(2) 神经炎的辅助治疗。(3) 用于维生素B_{12}的补充。

【注意事项】(1) 可致过敏反应，甚至过敏性休克，不宜滥用。(2) 有条件时，

用药过程中应监测血中维生素 B_{12} 浓度。(3) 治疗巨幼细胞贫血，在起始 48 小时，监测血钾水平，以防止低钾血症。(4) 对恶性贫血者（内因子缺乏）口服本品无效，须采用肌内注射给药。

【禁忌证】对维生素 B_{12} 有过敏史者禁用。有家族遗传性球后视神经炎及弱视症者禁用。

【不良反应】可见低血压、高尿酸血症。少见暂时轻度腹泻，罕见过敏性休克。

【用法与用量】肌内注射：①成人，一日 0.025 ~ 0.1 mg 或隔日 0.05 ~ 0.2 mg。用于神经炎时，用量可酌增。②儿童，一次 25 ~ 100 μg，一日或隔日 1 次。避免同一部位反复给药，且对新生儿、早产儿、婴儿、幼儿要特别小心。

【制剂与规格】维生素 B_{12} 片：0.25 mg。

维生素 B_{12} 注射液：①1 ml : 0.05 mg；②1 ml : 0.1 mg；③1 ml : 0.25 mg；④1 ml : 0.5 mg；⑤1 ml : 1 mg。

腺苷钴胺[保(乙)]

Cobamamide

【适应证】用于巨幼红细胞贫血、营养不良性贫血、妊娠期贫血、多发性神经炎、神经根炎、三叉神经痛、坐骨神经痛、神经麻痹等。也可用于营养性神经疾患以及放射线和药物引起的白细胞减少症的辅助治疗。

【注意事项】(1) 注射用溶液配制后遇光易分解，溶解后要尽快使用。(2) 治疗后期可能出现缺铁性贫血，应补充铁剂。神经系统损害者在诊断未明确前应慎用本品。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。家族遗传性球后视神经炎者禁用。

【不良反应】口服偶可引起过敏反应；肌内注射偶可引起皮疹、瘙痒、腹泻、过敏性哮喘、长期应用可出现缺铁性贫血。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 0.5 ~ 1.5 mg，一日 3 次，一日 1.5 ~ 4.5 mg。(2)肌内注射：一次 0.5~1.5 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】腺苷钴胺片：0.25 mg。

腺苷钴胺注射液：1 ml : 0.5 mg。

注射用腺苷钴胺：2 ml : 0.5 mg。

6.1.4 其他抗贫血药

重组人促红素[保(乙)]

Recombinant Human Erythropoietin

【适应证】用于肾衰竭患者的贫血；非肾性贫血（如恶性肿瘤、免疫疾病、艾滋病）；早产儿伴随的贫血；外科手术前自体储血等。

【注意事项】(1) 卟啉病者慎用。(2) 在用 rHuEPO 前，患者的高血压应得到控制。(3) 血清 EPO > 500 mU/ml 者一般无治疗反应。(4) 对肾性贫血患者须监测血细胞比容（目标为 30% ~ 36%），如增加过快（2 周内超过 4%）应减少 rHuEPO 的用量。(5) 治疗过程中应定期监测血清铁与转铁蛋白饱和度及叶酸，如有缺乏应及时补充。(6) 妊娠及哺乳期妇女尚不清楚，不宜使用。

【禁忌证】(1) 难以控制的高血压。(2) 对本品过敏者。

【不良反应】静脉给药约 10% 患者可出现自限性的流感样症状。偶有轻微的皮疹和荨麻疹。慢性肾衰竭患者在治疗早期，当血细胞比容（HCT）上升过快时，可出现血压升高及癫痫发作。

【用法与用量】(1) 慢性肾衰竭患者：首剂为 50 ~ 100 U/kg，一周 3 次。血液透析患者用静脉注射，非透析患者皮下注射。如治疗 8 周后 HCT 增加 < 5% ~ 6%，且 HCT 未达目标（30% ~ 36%），应增加剂量。维持剂量视患者情况而定。(2) 非肾性贫血患者：初次剂量为 100 ~ 150 U/kg，根据治疗反应调整用量，治疗 8 周后 HCT 不上升或达不到 40% 者应逐渐增加剂量到 300 ~ 350 U/kg；HCT 达到 40% 者，减量 25% 维持，疗程视患者情况而定。

【制剂与规格】重组人促红素注射液（中国仓鼠卵巢 CHO 细胞）：①1 ml : 2 000 U；②1 ml : 3 000 U；③1 ml : 4 000 U；④1 ml : 5 000 U；⑤1 ml : 9 000 U；⑥1 ml : 10 000 U；⑦1 ml : 12 000 U。

6.2 白细胞减少症及其药物治疗

外周血白细胞计数低于 4×10^9/L，称为白细胞减少症；中性粒细胞绝对值低于 1.5×10^9/L，称为粒细胞减少症；而中性粒细胞绝对值低于 0.5×10^9/L，称为粒细胞缺乏症。急性粒细胞缺乏症是指在某种因素下，短时间内外周血粒细胞陡降乃至完全缺乏，伴发热、严重感染的综合征。临床常用于治疗白细胞减少的药物有肌苷、重组人粒细胞集落刺激因子和重组人粒细胞 - 巨噬细胞集落刺激因子等。

重组人粒细胞集落刺激因子（rhG-CSF）可刺激中性粒细胞生成，缩短化疗相关的中性粒细胞减少时间和降低相应的脓毒血症发生率，但是没有证据提示 rhG-CSF 能够改善患者中性粒细胞减少症的总体生存率。在重症粒细胞减少或缺乏时选用 rhG-CSF 通常能提高患者的中性粒细胞计数。应用时间过长，rhG-CSF 可能会增加髓性肿瘤的风险。

肌苷 [保（甲/乙）]

Inosine

【适应证】用于急慢性肝炎，白细胞或血小板减少症，心脏疾患、眼科疾病（如中心视网膜炎、视神经萎缩）等的辅助治疗。

【注意事项】过敏体质者，妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见胃部不适、面部潮红、轻度腹泻、腹痛、恶心、胸部灼热感。

【用法与用量】(1) 口服：①成人一次 200 ~ 600 mg，一日 3 次；②儿童一次 200 mg，一日 3 次。(2) 静脉注射或静脉滴注：一次 200 ~ 600 mg，一日 1 ~ 2 次。(3) 肌内注射：一次 100 ~ 200 mg，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】肌苷片：200 mg。

肌苷注射液：① 2 ml ∶ 100 mg；② 5 ml ∶ 200 mg。

氨肽素 [保（乙）]

Amino-polypeptide

【适应证】用于血小板减少性紫癜、再生障碍性贫血、白细胞减少症。亦可用于银屑病。

【注意事项】用药至少 4 周，有效者可连续服用。妊娠及哺乳期妇女尚不明确。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】尚未见有关不良反应报道。

【用法与用量】口服：一次 1 g，一日 3 次。儿童用药酌减或遵医嘱。

【制剂与规格】氨肽素片：0.2 g。

利血生

Leucogen

【适应证】用于预防和治疗白细胞减少症及血小板减少症。

【注意事项】(1) 急、慢性髓细胞白血病患者慎用。(2) 妊娠及哺乳用药尚不明确。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】口服：一次 20 mg，一日 3 次或遵医嘱。

【制剂与规格】利血生片：① 10 mg；② 20 mg。

鲨肝醇 [保（乙）]

Batiol

【适应证】(1) 治疗各种原因引起的白细胞减少症，如放射性、抗肿瘤药等所致的白细胞减少症。(2) 治疗不明原因所致的白细胞减少症。

【注意事项】(1) 临床疗效与剂量相关，应根据个体化寻找最佳剂量。(2) 对病程较短，病情较轻及骨髓功能尚好者，本品疗效较好。(3) 用药期间应经常检查外周血象，尤其白细胞计数。

【不良反应】偶见口干，肠鸣音亢进。剂量过大可引起腹泻。

【用法与用量】口服：①成人，一日 50 ~ 150 mg，分 3 次服用，4 ~ 6 周为 1 个疗程。②儿童，一次 1 ~ 2 mg/kg，一日 3 次。

【制剂与规格】鲨肝醇片：① 20 mg；② 25 mg；③ 50 mg。

腺嘌呤（维生素 B_4）

Adenine

【适应证】用于防治各种原因引起的

白细胞减少症、急性粒细胞减少症，尤其是对肿瘤化学和放射治疗以及苯中毒等引起的白细胞减少症。

【注意事项】(1) 注射时，需溶于 2 ml 磷酸氢二钠缓冲液中，缓慢注射，不能与其他药物混合注射。(2) 由于此药是核酸前体，故与肿瘤化疗或放疗并用时，应考虑它是否有促进肿瘤发展的可能性。(3) 需连续使用 1 个月左右才能显效。(4) 妊娠及哺乳期慎用。

【不良反应】推荐剂量下，未见明显不良反应。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次 10 ~ 20 mg，一日 3 次。②儿童，一次 5 ~ 10 mg，一日 2 次。(2) 肌内注射或静脉注射：一日 20 ~ 30 mg。

【制剂与规格】腺嘌呤片：① 10 mg；② 25 mg。

注射用腺嘌呤：20 mg（附 2 ml 磷酸二氢钠缓冲液）。

榄香烯[保(乙)]

Elemene

【适应证】对癌性胸、腹水及某些恶性实体瘤有一定疗效。本品与放化疗同步治疗，可增强疗效，用于介入、腔内化疗及癌性胸腹水的辅助治疗。

【注意事项】(1) 高热、胸腹水合并感染的患者慎用。(2) 对血小板减少症，或有进行性出血倾向者慎用。(3) 部分病人在初次用药后，可有轻微发热，多在 38℃以下，于给药之前 30 分钟口服泼尼松或解热镇痛药可预防或减轻。(4) 本品腔内注射时可致少数患者疼痛，使用前应根据患者的具体情况使用局麻药，可减轻或缓解疼痛，使能够耐受。(5) 妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】部分患者用药后可有静脉炎、发热、局部疼痛、过敏反应、轻度消化道反应。

【用法与用量】静脉注射：一次 0.4 ~ 0.6 g，一日 1 次，2 ~ 3 周为 1 个疗程。

【制剂与规格】榄香烯乳注射液：5 ml ∶ 25 mg。

辅酶 A[保(乙)]

Coenzyme A

【适应证】辅酶类。用于白细胞减少症、原发性血小板减少性紫癜及功能性低热的辅助治疗。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 急性心肌梗死患者。

【不良反应】尚无发生不良反应的报道。

【用法与用量】成人，常用量：①静脉滴注：一次 50 ~ 200 U，一日 50 ~ 400 U。用 5% 葡萄糖注射液 500 ml 溶解后静脉滴注。②肌内注射：一次 50 ~ 200 U，一日 50 ~ 400 U。用氯化钠注射液 2 ml 溶解后肌内注射。

【制剂与规格】注射用辅酶 A：① 50 U；② 100 U；③ 200 U。

小檗胺[基(基)]

Berbamine

【适应证】用于各种原因引起的白细胞减少症。亦可用于预防癌症放疗、化疗后白细胞的减少。

【注意事项】妊娠及哺乳期妇女慎用，尤其是妊娠早期妇女。

【禁忌证】对本品过敏者、溶血性贫血患者、葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶缺乏的儿童（可致溶血性贫血而致黄疸）。

【不良反应】少数患者服药后出现头痛、无力、便秘、口干、呕吐、皮疹、药物热并伴有阵发性腹痛、腹胀等症状，但继续服药均能耐受，服药 1 周后不适症状可自行减轻、消失，但严重者建议停药。偶见心慌、咳喘。

【用法与用量】口服：一次 112 mg，一日 3 次；或遵医嘱。

【制剂与规格】盐酸小檗胺片：28 mg。

重组人粒细胞集落刺激因子[保(乙)]

Recombinant Human Granulocyte Colony-stimulating Factor (rhG-CSF)

【适应证】(1) 癌症化疗等原因导致中性粒细胞减少症。(2) 癌症患者使用骨髓抑制性化疗药物时，注射本品有助于预

防中性粒细胞减少症的发生，减轻中性粒细胞减少的程度，缩短粒细胞缺乏症的持续时间，加速粒细胞数的恢复，从而减少合并感染发热的危险性。(3) 促进骨髓移植后的中性粒细胞数升高。(4) 其他，包括骨髓发育不良综合征引起的中性粒细胞减少症、再生障碍性贫血，特发性中性粒细胞减少症、骨髓增生异常综合征伴中性粒细胞减少症。

【注意事项】(1) 本品应在化疗药物给药结束后 24～48 小时开始使用。(2) 妊娠或哺乳期妇女一般不建议应用，哺乳期妇女用药前应停止哺乳。(3) 老年人慎用。(4) 儿童慎用，并给予适当监测；对新生儿和婴幼儿的安全性尚未确定，建议不用。(5) 下列情况慎用：①髓性白血病而不伴有白细胞严重低下的患者；②镰状红细胞性贫血病患者。(6) 使用本品过程中应定期每周监测血象至少 2 次，特别是中性粒细胞数目变化的情况。(7) 应用本品有发生脾破裂的病例报道，故需要监测脾大小。

【禁忌证】(1) 对本品及对大肠埃希菌表达的其他制剂过敏者。(2) 严重肝、肾、心、肺功能障碍者。(3) 骨髓中幼稚细胞未显著减少的髓性白血病及外周血中存在幼稚细胞的髓性白血病患者。

【不良反应】(1) 肌肉骨骼系统，如肌肉酸痛、骨痛、腰痛、胸痛。(2) 消化系统，如胃肠道紊乱（厌食、恶心、呕吐及腹泻等），AST 及 ALT 升高。(3) 其他，如发热、头痛、乏力、皮疹、脱发、碱性磷酸酶和乳酸脱氢酶升高、注射部位反应及白细胞增多。(4) 极少数会出现休克、间质性肺炎、成人呼吸窘迫综合征、幼稚细胞增加。(5) 长期用药有时出现脾大，大多经影像学检查才发现。

【用法与用量】皮下或静脉注射给药：①肿瘤。用于化疗所致的中性粒细胞减少症等。成年患者化疗后，中性粒细胞数降至 1×10^9/L（白细胞计数 2×10^9/L）以下者，2～5 μg/kg，一日 1 次。儿童患者化疗后，中性粒细胞数降至 0.5×10^9/L（白细胞计数 1×10^9/L）以下者，2～5 μg/kg，一日 1 次。当中性粒细胞数连续 2 日回升至 3×10^9/L 以上时，停止给药。②急性白血病化疗所致的中性粒细胞减少症。白血病患者化疗后白细胞计数不足 1×10^9/L，骨髓中的原始粒细胞明显减少，外周血液中未见原始粒细胞的情况下，成年患者 2～5 μg/kg，一日 1 次。儿童患者 2 μg/kg，一日 1 次。当中性粒细胞数回升至 5×10^9/L（白细胞计数 10×10^9/L）以上时，停止给药。③骨髓增生异常综合征伴中性粒细胞减少症。成年患者在其中性粒细胞不足 1×10^9/L 时，2～5 μg/kg，一日 1 次。中性粒细胞数回升至 5×10^9/L 以上时，停止给药。④再生障碍性贫血所致中性粒细胞减少。成年患者在其中性粒细胞低于 1×10^9/L 时，2～5 μg/kg，一日 1 次。中性粒细胞数回升至 5×10^9/L 以上时，酌情减量或停止给药。⑤自身免疫性中性粒细胞减少症和慢性中性粒细胞减少症。成年患者中性粒细胞低于 1×10^9/L 时，1 μg/kg，一日 1 次。儿童患者中性粒细胞低于 1×10^9/L 时，1 μg/kg，一日 1 次。中性粒细胞数回升至 5×10^9/L 以上时，酌情减量或停止给药。⑥用于促进骨髓移植患者中性粒细胞增加：成人或儿童在骨髓移植的第 2 日至第 5 日开始用药，成人 5 μg/kg，一日 1 次；儿童 2 μg/kg，一日 1 次。中性粒细胞回升至连续 2 日超过 3×10^9/L 以上时，停止给药。

【制剂与规格】重组人粒细胞集落刺激因子注射液：① 3 ml : 75 μg；② 6 ml : 150 μg；③ 2 ml : 300 μg。

重组人粒细胞集落刺激因子冻干剂：① 50 μg；② 100 μg；③ 250 μg；④ 300 μg。

重组人粒细胞 - 巨噬细胞集落刺激因子［保（乙）］

Recombinant Human Granulocyte Macrophage Colony-stimulating Factor (rhGM-CSF)

【适应证】(1) 预防和治疗肿瘤放疗或化疗后引起的白细胞减少症。(2) 治疗骨髓造血功能障碍及骨髓增生异常综合征。(3) 预防白细胞减少可能潜在的感染并发症。(4) 加快感染引起的中性粒细胞减少的恢复。

【注意事项】(1) 对本品的治疗反应和耐受性个体差异较大，应在治疗前后定

期观察外周血白细胞或中性粒细胞、血小板数据的变化。血象恢复正常后立即停药或采用维持剂量。(2) 本品不应与抗肿瘤放、化疗药同时使用，应停药至少24小时后，方可使用。(3) 妊娠期妇女慎用，哺乳妇女在开始使用本品前应停止哺乳。(4) < 18岁及老年患者的安全性尚未确立。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 自身免疫性血小板减少性紫癜者。

【不良反应】最常见的不良反应为发热、寒战、恶心、呼吸困难、腹泻，一般的常规对症处理便可使之缓解；其次有皮疹、胸痛、骨痛和腹泻等。低血压和低氧综合征在首次给药时可能出现，但以后给药则无此现象。偶可发生急性过敏反应(支气管痉挛、血管性水肿、过敏性休克)。不良反应多发生于静脉注射和快速滴注及剂量一日> 32 μg/kg。

【用法与用量】(1) 肿瘤放、化疗后：放、化疗停止24 ~ 48小时后方可使用本品，用1 ml注射用水溶解本品（切勿剧烈振荡），在腹部、大腿外侧或上臂三角肌处进行皮下注射（注射后局部皮肤应隆起约1 cm^2，以便药物缓慢吸收），一日3 ~ 10 μg/kg，连续5 ~ 7日，根据白细胞回升速度和水平，确定维持量。(2) 骨髓移植：5 ~ 10 μg/kg，一日1次，静脉滴注4 ~ 6小时，如说明书允许也可皮下注射，持续应用至连续2日中性粒细胞绝对数≥ 1×10^9/L。(3) 骨髓增生异常综合征／再生障碍性贫血：一日3 μg/kg，皮下注射，需2 ~ 4日才观察到白细胞增高的最初效应，以后调节剂量使白细胞计数维持在所期望水平，通常< 10×10^9/L。

【制剂与规格】注射用重组人粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子：① 50 μg；② 75 μg；③ 100 μg；④ 150 μg；⑤ 300 μg。

6.3 特发性血小板减少性紫癜及其药物治疗

特发性血小板减少性紫癜（idiopathic thrombocytopenic purpura，ITP）是一种获得性出血性疾病。目前普遍认为它是由于体内产生的抗血小板自身抗体与血小板抗原结合，导致血小板迅速从循环中清除的一种自身免疫性疾病。根据临床特征可将本病分为急性型和慢性型。儿童ITP多表现为急性型，且大多患儿可完全恢复，仅10%左右的患儿发展为慢性ITP。成人ITP中约80%为慢性型。对于慢性ITP，若血小板计数 > 30×10^9/L 且无出血表现也可不予治疗。对于各型中出血较重者酌情选择以下药物治疗，首选糖皮质激素，重症急救时也可用静脉注射用人免疫球蛋白。常用药物和用法用量如下：

泼尼松 用于特发性血小板减少性紫癜初始治疗者及糖皮质激素治疗有效停药后复发者。常用剂量为一日0.5 ~ 1 mg/kg，重者可给予一日1.5 ~ 2 mg/kg，血小板≥ 100×10^9/L 并稳定后，逐步将剂量减至维持量，维持量不超过一日15 mg为宜，维持治疗一般为3 ~ 6个月。足量用药4周（最长不超过6周）仍无效者应快速减量至停药。(其他见5.4.4.2)

环孢素 用于难治性特发性血小板减少性紫癜。口服：常用量一日2.5 ~ 5 mg/kg，分2次，至少用药3个月。胶囊应整体吞服，若一日总用量不能等分为早、晚各一份时，可早、晚给不同剂量或选用口服液。由于疗效和不良反应均与剂量相关，用药期间应监测本品的血药浓度，谷浓度一般在100 ~ 200 ng/ml可产生免疫抑制作用，又不引起严重不良反应。(其他见8.8)

达那唑 用于难治性特发性血小板减少性紫癜。口服：一次200 mg，一日2～4次，疗程不少于2个月，逐步减量。(其他见12.7)

人免疫球蛋白 用于特发性血小板减少性紫癜重症患者急救用药。一日400 mg/kg，连续5日。用带有滤网的输液器进行静脉滴注；首次使用本品者开始滴速要慢，以不超过每分钟1 ml（每分钟10 ~ 20滴）为宜，持续15分钟无不良反应，可逐渐加快速度，但最快速度不超过每分钟3 ml。(见18.3.1.2)

长春新碱 用于特发性血小板减少性紫癜，剂量一次1～2mg，一周1次，静脉滴注，持续6～8小时，一般1个疗程4～6周。(其他见10.3.1.5)。

环磷酰胺 用于难治性特发性血小板减少性紫癜维持治疗。口服：一日2mg/kg，分2次口服，3个月为1个疗程。静脉注射：一次100～200mg，一日或隔日1次，连续4～6周。(其他见10.3.1.1)

硫唑嘌呤[基(基)] 用于难治性特发性血小板减少性紫癜维持治疗，期间与泼尼松合用以减少泼尼松用量。饭后以足量水吞服。一日1～3mg/kg，1次或分次口服，有效后酌减，可较长时间维持用药。(其他见7.1.2.3)

6.4 止血与凝血异常性疾病及其药物治疗

止血与凝血异常性疾病是指因先天或获得性原因，导致患者止血、凝血及纤维蛋白溶解等机制的缺陷或异常，并进一步引起自发性出血或轻度外伤后出血不止的一组疾病。该组疾病主要涉及血管、血小板及凝血因子的异常。治疗时，首先明确诊断，正确判断出血的原因，如血管因素、血小板因素，还是凝血因子数量或质量异常，然后根据病因应用如下药物。

酚磺乙胺[保(乙)]

Etamsylate

【适应证】用于防治各种手术前后的出血，也可用于血小板功能不良、血管脆性而引起的出血。

【注意事项】(1) 本品可与维生素K注射液混合使用，但不可与氨基己酸注射液混合使用。(2) 血栓栓塞性疾病（缺血性卒中、肺栓塞、深静脉血栓形成）患者或有此病史者慎用。(3) 肾功能不全者慎用。(4) 不得与碳酸氢钠注射液配伍使用，以免引起变色反应。(5) 勿与氨基酸混合注射，以免引起中毒。(6) 老年、儿童、妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】(1) 对本品及其中任何成分过敏者禁用。(2) 急性卟啉症患者禁用。

【不良反应】可有恶心、头痛、皮疹、暂时性低血压等，静脉注射后偶可发生过敏性休克。

【用法与用量】肌内注射、静脉注射或静脉滴注。用氯化钠注射液2ml溶解后使用，也可稀释于氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液中使用。①肌内注射或静脉注射：一次0.5g，一日0.5～1.5g。静脉滴注：一次0.5g，一日2～3次，或遵医嘱。②预防手术后出血：术前15～30分钟静脉滴注或肌内注射0.5g，必要时2小时后再注射0.25g，或遵医嘱。

【制剂与规格】注射用酚磺乙胺：0.5g。

氨基己酸[保(乙)]

Aminocaproic Acid

【适应证】适用于预防及治疗纤维蛋白溶解亢进引起的各种出血。(1) 前列腺、尿道、肺、肝、胰、脑、子宫、肾上腺、甲状腺等富有纤溶酶原激活物脏器的外伤或手术出血，组织纤溶酶原激活物(t-PA)、链激酶或尿激酶过量引起的出血。(2) 弥散性血管内凝血（DIC）晚期，以防继发性纤溶亢进症。(3) 可作为血友病患者拔牙或口腔手术后出血或月经过多的辅助治疗。(4) 可用于上消化道出血、咯血、原发性血小板减少性紫癜和白血病等各种出血的对症治疗，对一般慢性渗血效果显著。

【注意事项】(1) 本品排泄快，需持续给药，否则难以维持稳定的有效血浓度。(2) 对凝血功能异常引起的出血疗效差；对严重出血、伤口大量出血及癌肿出血等无止血作用。(3) 链激酶或尿激酶的作用可被氨基己酸对抗，故前者过量时亦可使用氨基己酸对抗。(4) 本品不能阻止小动脉出血，术中有活动性动脉出血，仍需结扎止血。(5) 使用避孕药或雌激素的妇女，服用氨基己酸时可增加血栓形成的倾向。(6) 本品静脉注射过快可引起明显血压降低、心律失常。(7) 尿道手术后出血的患者慎用。本品从尿排泄快，尿中浓度高，能抑制尿激酶的纤溶作用，可形成血凝块，阻塞尿路。因此，泌尿科术后有血尿的患者慎用。

(8) 心、肝、肾功能损害者慎用。(9) 妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】有血栓形成倾向或过去有血管栓塞者,弥散性血管内凝血高凝期患者。

【不良反应】常见恶心、呕吐和腹泻;其次为眩晕、瘙痒、头晕、耳鸣、全身不适、鼻塞、皮疹等。当一日剂量超过16g时,尤易发生。快速静脉滴注可出现低血压、心律失常,少数人可发生惊厥及心脏或肝脏损害。大剂量或疗程超过4周可产生肌痛、软弱、疲劳、肌红蛋白尿,甚至肾衰竭等,停药后可缓解恢复。

【用法与用量】(1) 口服:①成人一次2g,一日3～4次,依病情用7～10日或更久。②儿童:一次0.1g/kg,一日3～4次。(2) 静脉滴注:本品在体内的有效抑制纤维蛋白溶解的浓度至少为130μg/ml。对外科手术出血或内科大量出血者,迅速止血,要求迅速达到上述血液浓度。初量4～6g溶于100ml氯化钠注射液或5%～10%葡萄糖溶液中,于15～30分钟滴完。持续剂量为每小时1g,可滴注也可口服。(3) 局部应用:0.5%溶液冲洗膀胱用于术后膀胱出血;拔牙后可用10%溶液漱口和蘸药的棉球填塞伤口;亦可用5%～10%溶液纱布浸泡后敷贴伤口。

【制剂与规格】氨基己酸片:0.5g。

氨基己酸注射液:①10ml:2g;②20ml:4g。

氨甲环酸[保(甲/乙)]

Tranexamic Acid

【适应证】用于急性或慢性、局限性或全身性原发性纤维蛋白溶解亢进所致的各种出血。包括:①前列腺、尿道、肺、脑、子宫、肾上腺、甲状腺、肝等富有纤溶酶原激活物脏器的外伤或手术出血;②用作组织型纤溶酶原激活物(t-PA)、链激酶及尿激酶的拮抗物;③人工流产、胎盘早期剥落、死胎和羊水栓塞引起的纤溶性出血;④局部纤溶性增高的月经过多,眼前房出血及严重鼻出血;⑤防止或减轻凝血因子Ⅷ或凝血因子Ⅸ缺乏的血友病患者拔牙或口腔手术后的出血;⑥中枢动脉瘤破裂所致的轻度出血;⑦治疗遗传性血管神经性水肿,可减少其发作次数和严重度;⑧血友病患者发生活动性出血,可联合应用本药。

【注意事项】(1) 以下情况慎用,如血友病或肾盂实质病变发生大量血尿时,心功能损害者,肝、肾功能损害者和妊娠及哺乳期妇女。(2) 本品与其他凝血因子(如凝血因子Ⅸ)等合用,应警惕血栓形成。一般认为在凝血因子使用后8小时再用本品较为妥当。(3) 弥散性血管内凝血所致的继发性纤溶性出血,应在肝素化的基础上应用本品。(4) 前列腺手术出血时,用量应减少。(5) 长时间用本品,应做眼科检查监护(例如视力测验、视觉、视野和眼底)。(6) 蛛网膜下腔出血和颅内动脉瘤出血应用本品止血时优于其他抗纤溶药,但必须注意并发脑水肿或脑梗死的危险性,对于重症有手术指征患者,本品仅可作辅助用药。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 有血栓形成倾向或有纤维蛋白沉积时。

【不良反应】偶有药物过量所致颅内血栓形成和出血;尚有腹泻、恶心及呕吐;较少见经期不适;注射后少见视物模糊、头痛、头晕、疲乏等。

【用法与用量】(1) 口服:一次1～1.5g,一日2～6g。(2) 静脉注射或静脉滴注:一次0.25～0.5g,一日0.75～2g。以葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释后使用。

【制剂与规格】氨甲环酸片:①0.125g;②0.25g。

氨甲环酸注射液:①2ml:0.1g;②5ml:0.25g;③2ml:0.2g;④5ml:0.5g。

氨甲苯酸[基(基),保(甲/乙)]

Aminomethylbenzoic Acid

【适应证】用于纤维蛋白溶解过程亢进所致出血,如肺、肝、胰、前列腺、甲状腺、肾上腺等手术时的异常出血,妇产科和产后出血及肺结核咯血或痰中带血、血尿、前列腺肥大出血、上消化道出血等。此外,尚可用于由链激酶或尿激酶过量所引起的出血。

【注意事项】(1) 本品用量过大可促

进血栓形成，对有血栓形成倾向者、心肌梗死者慎用。

(2) 肾功能不全者、肾盂实质性病变发生大量血尿者、血友病者慎用。

(3) 本品对一般慢性渗血效果较显著，但对癌症出血以及创伤出血者无止血作用。

【禁忌证】对有血栓栓塞病史者禁用。

【不良反应】常见腹泻、恶心、呕吐；偶见用药过量导致血栓形成倾向。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次0.25～0.5 g，一日3次，一日最大剂量为2 g；5岁以下儿童一次0.1～0.125 g，一日2～3次。(2) 静脉注射：成人一次0.1～0.3 g，用5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液10～20 ml稀释后缓慢注射，一日最大用量0.6 g。新生儿一次0.02～0.03 g；5岁以下儿童一次0.05～0.1 g，

【制剂与规格】氨甲苯酸片：(1) 0.125 g；(2) 0.25 g。

氨甲苯酸注射液：(1) 5 ml : 0.05 g；(2) 10 ml : 0.1 g。

甲萘氢醌[保(甲)]

Menadiol

【适应证】用于维生素K缺乏所致的凝血障碍性疾病。

【注意事项】(1) 对葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺陷者谨慎用药。(2) 对肝素引起的出血倾向及凝血酶原时间延长无效。外伤出血无必要使用本品。(3) 用药期间应定期测定凝血酶原时间。(4) 肠道吸收不良患者，以采用注射途径给药为宜。(5) 肝功能损害时疗效不明显，盲目加量，反而加重肝脏损害。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 严重肝脏疾患或肝功能不全者；(3) 妊娠晚期。

【不良反应】恶心、呕吐等胃肠道反应；偶见过敏反应。

【用法与用量】(1) 口服：一次2～4 mg，一日3次。(2) 肌内或皮下注射：①成人，一次5～15 mg，一日1～2次；②儿童，一次5～10 mg，一日1～2次。

【制剂与规格】醋酸甲萘氢醌片：① 2 mg；② 4 mg；③ 5 mg。

醋酸甲萘氢醌注射液：① 1 ml : 5 mg；② 1 ml : 10 mg。

维生素 K_1[基(基)，保(甲/乙)]

Vitamin K_1

【适应证】用于维生素K缺乏引起的出血，如梗阻性黄疸、胆瘘、慢性腹泻等所致出血，香豆素类、水杨酸钠等所致的低凝血酶原血症，新生儿出血以及长期应用广谱抗生素所致的体内维生素K缺乏。

【注意事项】(1) 对肝素引起的出血倾向无效。(2) 静脉注射宜缓慢，给药速度不应超过每分钟1 mg。(3) 对严重梗阻性黄疸、小肠吸收不良所致腹泻者等，不宜使用。

【禁忌证】肝脏疾患或肝功能不良者。

【不良反应】静脉注射偶可发生过敏样反应，速度过快可出现面部潮红、出汗、支气管痉挛、心动过速、低血压等，曾有因快速静脉注射致死的报道；肌内注射可引起局部红肿和疼痛；新生儿可能出现高胆红素血症、黄疸和溶血性贫血。

【用法与用量】(1) 口服：一次10 mg，一日3次或遵医嘱。(2) 注射：①低凝血酶原血症，肌内或深部皮下注射，一次10 mg，一日1～2次，24小时内总量不超过40 mg。②预防新生儿出血，可于分娩前12～24小时给母亲肌内注射或缓慢静脉注射2～5 mg。也可在新生儿出生后肌内或皮下注射0.5～1 mg，8小时后可重复。

【制剂与规格】维生素 K_1 片：10 mg。

维生素 K_1 注射液：1 ml : 10 mg。

卡巴克络[保(乙)]

Carbazochrome

【适应证】用于因毛细血管损伤及通透性增加所致的出血，如鼻出血、视网膜出血、咯血、胃肠出血、血尿、痔疮及子宫出血等。

【注意事项】(1) 有癫痫史及精神病史的患者慎用。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(3) 本品水杨酸钠盐不能用于静脉注射。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 对水杨酸过敏者禁用本品水杨酸钠盐。

【不良反应】本品毒性低，可产生水杨酸样反应，如恶心、呕吐、头晕、耳鸣、

视力减退等。对癫痫患者可引起异常脑电活动。注射部位有痛感。

【用法与用量】(1) 口服：卡巴克络水杨酸钠盐片，成人一次 2.5 ~ 5 mg，一日 3 次。(2) 肌内注射：卡巴克络水杨酸钠盐注射液，成人一次 5 ~ 10 mg，一日 2 ~ 3 次。(3) 静脉滴注：卡巴克络磺酸钠盐注射液，成人静脉滴注一次 60 ~ 80 mg，临用前，加灭菌注射用水或 0.9% 氯化钠注射液适量使溶解。

【制剂与规格】卡巴克络水杨酸钠片 (卡络柳钠片)：① 2.5 mg；② 5 mg。

卡巴克络水杨酸钠注射液 (卡络柳钠注射液)：① 1 ml : 5 mg；② 2 ml : 10 mg。

卡巴克络磺酸钠注射液 (卡络磺钠注射液)：① 1 ml : 5 mg；② 2 ml : 10 mg。

鱼精蛋白[保(甲)]

Protamine

【适应证】用于因注射肝素过量所引起的出血。

【注意事项】(1) 本品易破坏，口服无效。禁与碱性物质接触。(2) 静脉注射速度过快可致热感、皮肤发红、低血压、心动过缓等。(3) 对鱼类过敏者应用时应注意。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】可见心动过缓、胸闷、呼吸困难及血压降低；肺动脉高压或高血压；恶心、呕吐、面部潮红、潮热及倦怠；极个别对鱼类食物过敏患者发生过敏反应；用鱼精蛋白锌胰岛素患者偶可发生严重过敏反应；可加重心脏手术体外循环所致的血小板减少。

【用法与用量】(1) 成人：静脉注射，抗肝素过量，用量与最后 1 次肝素使用量相当 (本品 1 mg 可中和 100 U 肝素)，但一次用量不超过 50 mg。缓慢静注。一般以每分钟 0.5 ml 的速度静注，在 10 分钟内注入量以不超过 50 mg 为度。2 小时内 (即本品作用有效持续时间内) 不宜超过 100 mg。除非另有确凿依据，不得加大剂量。(2) 儿童：①静脉滴注，抗自发性出血，一日 5 ~ 8 mg/kg，分 2 次，间隔 6 小时，每次以 300 ~ 500 ml 氯化钠注射液稀释后使用，3 日后改用半量。一次用量不超 25 mg。②缓慢静脉注射，抗肝素过量，用量与最后一次肝素使用量相当。一般用其 1% 溶液，每次不超过 2.5 ml (25 mg)。

【制剂与规格】硫酸鱼精蛋白注射液：① 5 ml : 50 mg；② 10 ml : 100 mg。

凝血酶[基(基)，保(甲)]

Thrombin

【适应证】用于手术中不易结扎的小血管止血、消化道出血及外伤出血等。

【注意事项】(1) 严禁注射。如误入血管可导致血栓形成、局部坏死危及生命。(2) 必须直接与创面接触，才能起止血作用。(3) 应新鲜配制使用。(4) 妊娠期妇女仅在具有明显指征下，病情必需时才能使用。

【禁忌证】对本品有过敏史或过敏体质者。

【不良反应】偶可致过敏反应；外科止血中应用本品曾有致低热反应的报道。

【用法与用量】(1) 局部止血：用 0.9% 氯化钠注射液溶解成 50 ~ 200 U/ml 的溶液喷雾或用本品干粉喷撒于创面。(2) 消化道止血：用 0.9% 氯化钠注射液或温开水 (不超 37℃) 溶解成 10 ~ 100 U/ml 的溶液，口服或局部灌注，也可根据出血部位及程度增减浓度、次数。

【制剂与规格】凝血酶冻干粉：① 200 U；② 500 U；③ 1 000 U；④ 2 000U；⑤ 5 000 U；⑥ 10 000 U。

血凝酶[保(乙)]

Hemocoagulase

【适应证】用于需减少流血或用于止血的各种医疗情况，如外科、内科、妇产科、眼科、耳鼻喉科、口腔科等临床科室的出血及出血性疾病；也可用来预防出血，如手术前用药，可避免或减少手术部位及手术后出血。

【注意事项】(1) 播散性血管内凝血及血液病所致的出血不宜使用。(2) 血中缺乏血小板或某些凝血因子时，宜在补充血小板或缺乏的凝血因子、或输注新鲜血液的基础上应用。(3) 原发性纤溶系统亢进的情况下宜与抗纤溶酶的药物合用。(4) 防止用药过量，否则其止血作用会降

低。(5) 用药期间应监测患者的出、凝血时间。(6) 血凝酶含有两种有效成分，矛头蝮蛇巴曲酶和磷脂依赖性凝血因子X激活酶。(7) 妊娠期妇女不宜使用。

【禁忌证】(1) 对本药或同类药物过敏者。(2) 有血栓病史者。

【不良反应】偶见过敏样反应。

【用法与用量】灭菌注射用水溶解，静脉、肌内或皮下注射，也可局部用药。(1) 一般出血：成人1～2kU；儿童0.3～0.5kU。(2) 紧急出血：立即静脉注射0.25～0.5kU，同时肌内注射1kU。(3) 外科手术：术前1日晚肌内注射1kU，术前1小时肌内注射1kU，术前15分钟静脉注射1kU，术后3日，每日肌内注射1kU。(4) 咯血：每12小时皮下注射1kU，必要时，开始时再加静脉注射1kU，最好是加入10ml的0.9%氯化钠注射液中注射。(5) 异常出血：剂量加倍，间隔6小时肌内注射1kU，至出血完全停止。(6) 局部外用：本药溶液可直接以注射器喷射于血块清除后的创面局部，并酌情以敷料压迫(如拔牙、鼻出血等)。

【制剂与规格】注射用血凝酶：① 1 U；② 2 U。

注射用尖吻蝮蛇血凝酶：1 U。

注射用白眉蛇毒血凝酶：① 0.5 U；② 2 U。

凝血酶原复合物

Prothrombin Complex

【适应证】预防和治疗因凝血因子Ⅱ、凝血因子Ⅶ、凝血因子Ⅸ、凝血因子X缺乏导致的出血，如乙型血友病、严重肝病及弥散性血管内凝血（DIC）等；用于逆转抗凝药，如双香豆素类及茚满二酮等诱导的出血；预防和治疗已产生因子Ⅷ抑制性抗体的甲型血友病患者。

【注意事项】(1) 除肝病出血患者外，一般在用药前应确诊患者是缺乏凝血因子Ⅱ、凝血因子Ⅶ、凝血因子Ⅸ、凝血因子X方能对症下药。(2) 婴幼儿易发生血栓性并发症，应慎用。(3) 用药期间应定期进行活化部分凝血活酶时间、纤维蛋白原、血小板及凝血酶原时间监测，以早期发现血管内凝血等并发症。(4) 乙型血友病用药期间应一日检测凝血因子Ⅸ血浆浓度，并据此调整用量。(5) 近期接受外科手术者应权衡利弊，斟酌使用。(6) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(7) 肝脏疾病者应权衡利弊，斟酌使用。

【不良反应】少数患者会出现面部潮红、眼睑水肿、皮疹及呼吸急促等过敏反应，严重者甚至血压下降或过敏性休克；偶可伴发血栓形成；快速滴注可出现发热、寒战、头痛、潮红、恶心、呕吐及气短；A、B或AB血型患者大量输注时，偶可发生溶血。

【用法与用量】(1) 用法：①用前应先将本品和灭菌注射用水或5%葡萄糖注射液预温至20～25℃，按瓶签标示量注入预温的灭菌注射用水或5%葡萄糖注射液，轻轻转动直至本品完全溶解（注意勿使产生很多泡沫）。②可用0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液稀释成50～100ml，然后用带有滤网装置的输血器进行静脉滴注。滴注速度开始要缓慢，15分钟后稍加快滴注速度，一般每瓶200ml中血浆当量单位（PE）在30～60分钟滴毕。③静脉滴注时，医师要随时注意使用情况，若发现弥散性血管内凝血或血栓的临床症状和体征，要立即终止使用，并用肝素拮抗。(2) 用量：静脉滴注，根据患者体重、出血类型及需要提高的凝血因子血浆浓度而定其用量。一般每千克体重输注10～20PE，以后凝血因子Ⅶ缺乏者每隔6～8小时，凝血因子Ⅸ缺乏者每隔24小时，凝血因子Ⅱ和凝血因子X缺乏者，每隔24～48小时，可减少或酌情减少剂量输用，一般历时2～3日。(3) 在出血量较大或大手术时可根据病情适当增加剂量。(4) 凝血酶原时间延长患者如拟做脾切除者要先于手术前用药，术中和术后根据病情决定。

【制剂与规格】冻干人凝血酶原复合物：① 100 PE；② 200 PE；③ 300 PE；④ 400 PE。

人纤维蛋白原[保(乙)]

Human Fibrinogen

【适应证】(1) 先天性纤维蛋白原减少或缺乏症。(2) 获得性纤维蛋白原减少

症：严重肝脏损伤、肝硬化、弥散性血管内凝血、产后大出血、因大手术（外伤或内出血等）引起的纤维蛋白原缺乏而造成的凝血障碍。

【注意事项】(1) 本品专供静脉输注。(2) 本品溶解后为澄清略带乳光的溶液，允许有少量细小的蛋白颗粒存在，为此用于输注的输血器应带有滤网装置，但如发现有大量或大块不溶物时，不可使用。(3) 在寒冷季节溶解本品或制品刚从冷处取出温度较低的情况下，应特别注意先使制品和溶解液的温度升高到 30 ~ 37℃，然后进行溶解，温度过低往往会造成溶解困难并导致蛋白变性。(4) 本品一旦溶解应尽快使用（2 小时内滴注完毕）。(5) 孕妇及哺乳期妇女慎用

【不良反应】少数过敏体质患者会出现变态反应，如出现皮疹、发热等严重反应者应采取应急处理措施。

【用法与用量】(1) 用法：使用前先将本品及灭菌注射用水预温至 30 ~ 37℃，然后按瓶签标示量注入预温的灭菌注射用水，置 30 ~ 37℃水浴中，轻轻摇动使制品全部溶解（切忌剧烈振摇以免蛋白变性）。用带有滤网装置的输液器进行静脉滴注。滴注速度一般以每分钟 60 滴左右为宜。(2) 用量：应根据病情及临床检验结果决定，一般首次给药 1 ~ 2 g，如需要可遵照医嘱继续给药。

【制剂与规格】冻干人纤维蛋白原：2.0 g。

人凝血因子Ⅷ [保（乙）]

Human Blood Coagulation Factor Ⅷ

【适应证】防治甲型血友病和获得性因子Ⅷ缺乏症伴发的出血（包括该类患者手术中及手术后出血）。其冷沉淀物亦可用于治疗血管性血友病、低纤维蛋白原血症及因子Ⅷ缺乏症。并可作为纤维蛋白原的来源用于弥散性血管内凝血。

【注意事项】对蛋白过敏者可能发生过敏反应；用药过程中定期做抗体测定和定期监测血浆凝血因子Ⅷ浓度；大量或多次使用时监测血细胞比容；用药前及给药中监测脉搏；使用猪血浆纯化的凝血因子Ⅷ时，监测血小板计数。

【不良反应】可能出现过敏反应，严重者血压下降及休克；由纯化猪血浆制备的产品可引起血小板减少及出血；注射局部烧灼感或炎症；偶见头晕、疲乏、口干、鼻出血、恶心及呕吐等；A、B 或 AB 血型患者大量输注时偶见溶血；有高纤维蛋白原血症或血栓形成的报道。

【用法与用量】(1) 静脉注射，其用量视病情、患者体重、出血类型、需要提高的凝血因子Ⅷ血浆浓度及体内是否存在抗体而定。以人血浆制品为例，输注剂量参考下列公式。所需因子Ⅷ剂量 (U) = 患者体重 (kg) × 需提高的因子Ⅷ浓度 × 0.5。按世界卫生组织 (WHO) 标准，1 U 因子约相当于 1 ml 新鲜血浆中因子Ⅷ的活性，可提高血浆因子Ⅷ浓度 2%。(2) 预防自发性出血：25 ~ 40 U/kg，一周 3 次。(3) 治疗出血：①轻度出血。8 ~ 15 U/kg 或将血浆凝血因子Ⅷ水平提高到正常人水平的 20% ~ 40% 的剂量。多数单次用药即可有效。若出血不止，可每 8 ~ 12 小时重复上述剂量，根据需要维持 1 ~ 3 日。②中度出血。首次剂量 15 ~ 25 U/kg 或将血浆因子Ⅷ浓度提高到正常人水平的 30% ~ 50%。如需要，每隔 8 ~ 12 小时注射 10 ~ 15 U/kg。③严重出血或出血累及重要器官。首次 30 ~ 50 U/kg 或血浆因子Ⅷ浓度提高到正常人水平的 60% ~ 100% 的剂量，然后每 8 ~ 12 小时注射 20 ~ 25 U/kg。(4) 控制围手术期的出血：①拔牙。术前 1 小时注射使血浆凝血因子Ⅷ浓度提高至正常人 30% ~ 50% 的剂量。术后若发生出血，可重复上述剂量。②小型手术。术前 1 小时注射相当于上述治疗中度出血的剂量。必要时 8~12 小时后再给予 10 ~ 15 U/kg。③大型手术。术前 1 小时注射相当于上述治疗重度出血的剂量。5 小时再给半量。术后 10 ~ 14 日应将血浆因子Ⅷ浓度维持在正常的 30% 或以上。

【制剂与规格】冻干人凝血因子Ⅷ：① 50 U；② 100 U；③ 200 U；④ 250 U；⑤ 300 U；⑥ 400 U；⑦ 500 U；⑧ 1 000U。

注射用人血浆凝血因子Ⅷ浓缩剂：① 200 U；② 250 U；③ 500 U；④ 750 U；⑤ 1 000 U；⑥ 1 500U。

注射用基因重组凝血因子Ⅷ浓缩剂：①250 U；②500 U；③1 000 U。

6.5 白血病及其用药

白血病是造血干／祖细胞的克隆性恶性增生性疾病。白血病细胞的分化阻滞可出现在造血干／祖细胞发育的不同阶段，急性白血病是阻滞发生在较早阶段。根据白血病细胞的系别表型特征，急性白血病又分为急性髓性白血病（AML）和急性淋巴细胞白血病(ALL)。按照FAB分型，急性髓性白血病又分为M_0～M_7八个类型，急性淋巴细胞白血病又分为急性B淋巴细胞和T淋巴细胞白血病。白血病主要临床表现有贫血、感染、出血及肝脾淋巴结浸润等。目前化学药物治疗仍然是最基本的治疗，急性早幼粒细胞白血病（M_3型白血病）首选维A酸、亚砷酸药物治疗。

6.5.1 急性髓性白血病的化学药物治疗

6.5.1.1 常用化疗药物

常用化疗药物见表6-1。

6.5.1.2 常用化疗方案

（1）诱导缓解治疗：标准诱导缓解治疗采用蒽环类或高三尖杉酯碱联合阿糖胞苷，常用的有DA(DNR+AraC)、IA(Ida+AraC)和HA(HHRT+AraC)方案，在此基础上还可加用VP16或6MP(或6TG)等。

（2）缓解后治疗：常用缓解后治疗方案主要为蒽环类联合不同剂量AraC，共治疗2～6个疗程，其中包括大剂量或中剂量阿糖胞苷（每12小时1～3 g/m^2，3日），联合化疗1～4个疗程。

伊达比星

Idarubicin

【适应证】(1) 用于成人未经治疗的急性髓性白血病的诱导缓解和成人复发和难治性急性髓性白血病的诱导缓解。(2) 用于成人和儿童的急性淋巴细胞性白血病的二线治疗。

【注意事项】(1) 应在有白血病化疗经验的医师指导下进行。(2) 除非在利大于弊的情况下，否则由于先前药物治疗或放疗引起骨髓抑制的患者不可使用本品。(3) 开始治疗前应控制任何全身性感染。(4) 已有心脏疾病及先前使用高蓄积量蒽环类治疗，或者其他具潜在心脏毒性药物的使用都会增加本品诱发心脏毒性的危险。(5) 治疗过程中应仔细监测血象、心脏功能。(6) 治疗前和治疗中应常规监测肝、肾功能（以血清胆红素和血清肌酐作为指标）。(7) 老年人用本药后易出现骨髓抑制，故应予以积极的支持治疗。(8) 由于白血病细胞迅速崩解，可能会引起继发性的高尿酸血症。因此必须监测血中尿酸浓度，如高尿酸血症继续发展，应予以适当的治疗。(9) 外溢于静脉注射部位时可能引起严重的局部组织坏死。注射部位的刺痛和灼伤感意味着少量外渗，此时应停止输注，改用其他静脉。(10) 育龄妇女应被告诫采取避孕。(11) 使用本

表6-1 常用化疗药主要用于急性髓性白血病的剂量范围和用法

药物名称	常用剂量	给药途径	给药天数（日）
高三尖杉酯碱（HHRT）	2.5～3 mg/m^2	静脉滴注	7
柔红霉素（DNR）	40～60 mg/m^2	静脉滴注	3
阿糖胞苷（AraC）	100～200 mg/m^2	一日分2次，静脉滴注	7
米托蒽醌（mito）	2～12 mg/m^2	静脉滴注	3
伊达比星（Ida）	8～12 mg/m^2	静脉滴注	3
依托泊苷（VP16）	100 mg/m^2	静脉滴注	5
安吖啶（m-AMSA）	50～70 mg/m^2	静脉滴注	5
阿柔比星（ACM-A）	一日15～20 mg	静脉滴注	5～7
吡柔比星（THP）	25～40 mg/m^2	静脉滴注	3
巯嘌呤（6MP）	100 mg/m^2	口服	–
硫鸟嘌呤（6TG）	100 mg/m^2	口服	–

品1～2日后，尿出现红染，应告知患者无须惊慌。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女，肝肾功能严重损伤的患者，感染未得到控制的患者，对本品及其他蒽环类抗肿瘤药过敏者。

【不良反应】主要的不良反应为严重的骨髓抑制（表现为白细胞、红细胞、血小板减少）和心脏毒性（表现为致命性充血性心力衰竭、急性心律失常和心肌病）。其他不良反应有脱发，绝大多数患者为可逆性；恶心、呕吐；黏膜炎，通常主要是口腔黏膜炎，出现于开始治疗后3～10日；食管炎和腹泻；发热，寒战，皮疹；肝脏酶类和胆红素增高的发生率为20%～30%，单独使用本品或与阿糖胞苷合用会产生严重的，有时甚至是致命的感染。

【用法与用量】通常根据体表面积计算剂量。静脉注射：①成人急性髓性白血病。与阿糖胞苷联合用药，推荐剂量为一日8～12 mg/m^2，连续3日。②急性淋巴细胞性白血病。作为单独用药，成人的推荐剂量为一日12 mg/m^2，连续3日；儿童10 mg/m^2，连续3日。所有的给药方案均应考虑到患者的血象以及在联合用药期间其他细胞毒药物的使用剂量而调整。配制，每瓶5 mg溶于5 ml注射用水，每瓶10 mg溶于10 ml注射用水。溶解后经过通畅的输注管与0.9%氯化钠注射液一起在5～10分钟注入静脉内。这样可减少血栓形成的危险和药物外溢后引起的严重蜂窝织炎及坏死。小静脉注射或在同一静脉内反复注射可能造成静脉硬化。

【制剂与规格】注射用盐酸伊达比星：①5 mg；②10 mg。

安吖啶[保（乙）]

Amsacrine

【适应证】用于成人急性白血病，尤其是成人急性髓性白血病的诱导缓解及缓解后治疗阶段，本品可与其他类型的抗急性白血病药物组成联合化疗方案以治疗成人复发性、难治性的急性白血病、慢性髓性白血病急变期。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 在使用本药阶段密切观察外周血象，肝、肾功能，血电解质等动态改变。(3) 对有血钾低等电解质紊乱的患者，在用本药前应予纠正，以免发生心律失常等心脏毒性。(4) 当采用较大剂量本品或与其他抗白血病药物联合应用时可能产生严重的骨髓抑制，要重视防治感染和出血的处理。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠早期妇女。

【不良反应】(1) 严重的不良反应为骨髓抑制，其中以周围血白细胞减低最常见，其次为血小板减少，严重者可出现全血细胞减少。造血抑制的程度与药物剂量和用药前的骨髓造血功能情况有关。当本品的疗程总量超过200 mg/m^2 时多伴程度不一的骨髓抑制。(2) 消化道较常见的是口腔炎、黏膜炎、胃纳减退，较少见的有恶心、呃逆、呕吐、腹泻等。(3) 心血管不良反应虽较少，但如发生也可能很严重。(4) 其他会出现肝肾功能损害，可有脱发，个别可发生癫痫。

【用法与用量】成人，诱导缓解，须根据患者血象、病情及耐受程度，按体表面积一日静脉滴注50～70 mg/m^2，如患者能耐受则可考虑连续滴注5日，1个疗程总量约350 mg/m^2 为宜，每3～4周重复1个疗程，如患者不能耐受则用药日数可减少。成人缓解后继续治疗剂量为诱导缓解的半量，静脉滴注，每4～8周重复1个疗程。

【制剂与规格】安吖啶注射液：1.5 ml：75 mg。

6.5.2 急性早幼粒细胞白血病的化学药物治疗

6.5.2.1 诱导缓解

采用全反式维A酸（ATRA）（一日40 mg/m^2，连续口服）联合砷剂，酌情可加小剂量蒽环类或羟基脲为基础的治疗；即ATRA＋砷剂±小剂量化疗（砷剂用量为0.1%亚砷酸注射液5～10 ml，缓慢静脉滴注，一日1次。亦可用口服含砷制剂代替）。

6.5.2.2 缓解后治疗

以蒽环类为基础的化疗方案巩固至

少2个疗程，再采用每天0.1%亚砷酸注射液10 ml，静脉滴注3～4周为1个疗程，之后可采用化疗药物与亚砷酸交替治疗，待证明已取得分子生物学水平完全缓解后，应用ATRA一日40 mg/m²（每3个月用15日）加6 MP一日60 mg/m²和MTX一周10 mg/m²间断治疗至少2年。

维A酸[基(基)，保(甲/乙)]

Tretinoin

【适应证】用于治疗急性早幼粒细胞白血病（APL），并可作为维持治疗药物。

【注意事项】口服本品出现不良反应时，应控制剂量或与谷维素、维生素B_1、维生素B_6等同服，可使头痛等症状减轻或消失。

【禁忌证】对本品及阿维酸A酯、异维A酸和其他维生素A衍生物过敏者，严重肝、肾功能损害者和妊娠期妇女。

【不良反应】常见口干、水肿、唇炎，皮肤和黏膜干燥，结膜炎，甲沟炎，脱发；高血脂，多发生于治疗后2～3个月；可出现头痛、头晕（50岁以下者较老年人多）、颅内压增高、目眩、忧郁、疲劳、嗜睡、心律失常、咳嗽、呼吸困难、胸痛、关节及肌肉痛、骨增厚、脱屑以及对光过敏、皮肤色素变化等；亦有脑水肿、白细胞增高及肝、肾损害等。

【用法与用量】(1) 急性早幼粒细胞白血病：一般一日20～45 mg/m²（或40～80 mg），分次口服（一次20 mg，一日2～4次，也可增至一日100 mg），疗程4～8周。(2) 儿童剂量：一日0.5～1 mg/kg，分1～3次口服。6～8周为1个疗程，达完全缓解所需总剂量平均4 000 mg。完全缓解后，应继续治疗（与其他化疗药物交替治疗），至少维持2～3年。

【制剂与规格】维A酸片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

维A酸胶囊：20 mg。

亚砷酸[保(乙)]

Arsenious Acid

【适应证】首选急性早幼粒细胞白血病，其次用于慢性髓性白血病及其加速期及原发性肝癌晚期。

【注意事项】(1) 在M_3型白血病治疗过程中部分患者有白细胞增高现象，常在用药2～3周时，不必停止治疗，1周后白细胞可自行下降，必要时可口服羟基脲降低白细胞。(2) 用药过程中部分患者AST及ALT可轻度增高，可加用保肝药，停药2周后可恢复至用药前水平。(3) 用药期间不宜哺乳。(4) 儿童不宜作为首选药。(5) 用药期间出现外周血白细胞过高时，可酌情选用白细胞单采分离，或应用羟基脲、高三尖杉酯碱、阿糖胞苷等药。(6) 本品为医疗用毒性药物，遇未按规定用法与用量用药而发生急性中毒者，可用二巯丙醇等药物解救。

【禁忌证】长期接触砷或有砷中毒者，非白血病所致的严重肝、肾功能损害者，孕妇禁用。

【不良反应】可见消化道不适、皮肤干燥、色素沉着、心电图异常改变等、停药或相应处理后可逐渐恢复正常。

【用法与用量】(1) 一日5～10 mg，日剂量不超过10 mg，本品加入250～500 ml氯化钠注射液或5%葡萄糖溶液中，一日1次，静脉滴注，3～4小时滴完。(2) 诱导缓解治疗。连续用药28日为1个疗程，未缓解者继续治疗直至完全缓解；复发及难治患者连续用药28日而效果不明显者，可适当增加剂量。(3) 巩固维持治疗。完全缓解后必须给予巩固治疗，28日为1个疗程，连续用药5年，第1、2、3年各疗程之间间隔为1、2、3个月，第4、5年各疗程间隔4～5个月。(4) 儿童，一次0.16 mg/kg。

【制剂与规格】亚砷酸注射液：① 5 ml∶5 mg；② 10 ml∶10 mg。

6.5.3 急性淋巴细胞白血病的化学药物治疗

6.5.3.1 常用化疗药物

常用化疗药物见表6-2。

6.5.3.2 常用化疗方案

(1) 前体B-ALL和前体T-ALL

①诱导缓解治疗：通常采用VCR、泼尼松和蒽环类（主要是DNR）为主的常规诱导缓解方案，上述三药方案基础上

表 6-2 常用急性淋巴细胞白血病化疗药物的剂量范围和用法

药物名称	常用剂量	给药途径	给药频次
环磷酰胺（CY）	400 ~ 800 mg/m²	静脉注射	一周 2 次
甲氨蝶呤（MTX）	10 ~ 30 mg/m²	静脉注射或口服	一周 1 ~ 2 次
长春新碱（VCR）	1.5 mg/m²	静脉注射	一周 1 次
左旋门冬酰胺酶（L-ASP）	6 000 U/m²	静脉注射	一日或隔日 1 次
替尼泊苷（VM26）	165 mg/m²	静脉注射	一周 2 次
泼尼松	40 ~ 60 mg/m²	口服	一日 1 次

还可加用 L-ASP 和（或）CY（T-ALL 亦可加用 AraC），治疗周期一般为 4 ~ 6 周。

②缓解后治疗：联合多种药物（蒽环类、鬼臼类、AraC、MTX、CY、VCR、泼尼松等）进行周期性强化治疗。巩固强化治疗中常使用大剂量 AraC（每 12 小时 1 ~ 3 g/m²，4 ~ 12 次，适用于 T-ALL）和大剂量 MTX（一次 0.5 ~ 6 g/m²，适用于 B-ALL）。维持治疗使用 6MP（或 6TG）75 ~ 100 mg/m²，一日 1 次和 MTX 20 mg/m²，一周 1 次，需历时 2 ~ 3 年，其间可加用原诱导方案作定期再强化治疗。

(2) Burkitt 白血病：采用特殊短程强烈化疗。前期治疗先予 CY 一日 200 mg/m² 加泼尼松 60 mg/m²，共 5 日。继予大剂量 MTX（1.5 g/m²，第 1 日）、大剂量 CY（200 mg/m²，1 ~ 5 日）或异环磷酰胺（800 mg/m²，1 ~ 5 日）加或不加大剂量 AraC 联合 VCR、蒽环类、VM26、地塞米松做短程周期治疗，完成 6 ~ 8 个疗程后停药不再维持。

(3) 其他药物还有如下几种。

环磷酰胺 见 10.3.1.1。

左旋门冬酰胺酶 见 10.3.1.6。

替尼泊苷 见 10.3.1.4。

泼尼松 见 5.4.4.2。

6.5.4 慢性髓性白血病的化学治疗药物

慢性髓性白血病（chronic myelogenous leukemia，CML）是造血干细胞克隆性增殖所致的骨髓增殖性疾病。临床特征为进行性外周血白细胞增多，可见到各阶段不成熟粒细胞，嗜碱性及嗜酸性粒细胞增多，骨髓有核细胞极度增多，以粒细胞系为主，幼稚中性粒细胞及成熟粒细胞明显增多，肝大、脾大，骨髓细胞具有特征性的 Ph 染色体 [t（9；22）] 和 bcr/abl 融合基因。

CML 患者的药物治疗包括化疗、生物治疗及分子靶向治疗。

伊马替尼 口服慢性期剂量一日 400 mg；加速期、急变期为一日 600 mg，一日 1 次，于进餐时服用。（其他见 10.3.4.2）

α-干扰素 18 岁以上患者皮下或肌内注射 8 ~ 12 周，第 1 ~ 3 日一日 300 万 U，第 4 ~ 6 日一日 600 万 U，第 7 ~ 84 日一日 600 万 U。至少治疗 8 周。（其他见 10.3.3）

羟基脲 一般剂量一日 2 ~ 4 g，白细胞下降后减量，直至达到血液学完全缓解，以后用一日 0.5 ~ 1.0 g 维持。（其他见 10.3.1.2）

白消安 成人，一日 4 ~ 6 mg/m²。如白细胞数下降至 20×10^9/L 则需酌情停药。或给维持量一日或隔日 1 ~ 2 mg，以维持白细胞计数在 10×10^9/L 左右。（其他见 10.3.1.1）

6.6 升血小板药

重组人血小板生成素[保（乙）]

Recombinant Human Thrombopoietin

【适应证】用于治疗实体瘤化疗后所致的血小板减少症，适用对象为血小板低于 50×10^9/L 且医师认为有必要升高血小

板治疗的患者。

【注意事项】(1) 本品过量应用或常规应用于特异体质者可造成血小板过度升高。(2) 本品应在化疗结束后 6 ~ 24 小时开始使用。(3) 使用本品过程中应定期检查血常规，一般应隔日 1 次，密切注意外周血小板计数的变化，血小板计数达到所需指标时，应及时停药。(4) 妊娠及哺乳期妇女不宜应用。

【禁忌证】(1) 对本品及其中成分过敏者。(2) 严重心、脑血管疾病者。(3) 患有其他血液高凝状态疾病者，近期发生血栓病患者。(4) 合并严重感染者，宜控制感染后再使用本品。

【不良反应】偶有发热、寒战、肌肉酸痛、膝关节痛、头晕、头痛、血压升高等，一般不需处理，多可自行恢复。

【用法与用量】恶性实体肿瘤化疗时，预计药物剂量可能引起血小板减少及诱发出血且需要升高血小板时，可于给药结束后 6 ~ 24 小时皮下注射本品，剂量为一日 300 U/kg，一日 1 次，连续应用 14 日；用药过程中待血小板计数恢复至 $100\times10^9/L$ 以上，或血小板计数绝对值升高 $\geq 50\times10^9/L$ 时即应停用。当化疗中伴发白细胞严重减少或出现贫血时，本品可分别与重组人粒细胞集落刺激因子(rhG-CSF)或重组人红细胞生成素 (rhEPO) 合并使用。

【制剂与规格】重组人血小板生成素注射液：① 1 ml ： 7 500 U；② 1 ml ： 15 000 U。

第 7 章 风湿免疫与骨科疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 关节痛
- 类风湿关节炎
- 强直性脊柱炎
- 银屑病关节炎
- 骨关节炎
- 系统性红斑狼疮
- 多发性肌炎和皮肌炎
- 韦格纳肉芽肿
- 风湿热
- 痛风
- 运动系统慢性损伤
- 骨病

7.1 风湿病及其药物治疗

风湿病（rheumatic diseases）包括因多种不同病因累及骨骼肌、关节的疾病，故又称肌骨骼系统病。这些疾病除有局部肌肉、关节的急、慢性疼痛和（或）相应的症状外，往往有累及其他多个系统的症状。其病因有炎症、自身免疫、代谢或感染后反应异常等。它们的发病机制各异，以致各病的症状组合重叠但又各不相同。

治疗风湿病时，因对其病因不明或不能去除病因，因此治疗上常采取对症的及控制疾病进展的两类药物。前者主要针对关节痛或肿、腰或脊柱痛、高热等采取对症治疗；后者则诱导疾病进入缓解状态，并保持关节、器官、组织的功能。

7.1.1 常见的风湿病及其药物治疗

7.1.1.1 关节痛和关节炎及其药物治疗

关节痛(arthralgia)和关节炎(arthritis)时关节是最常累及的组织，受累后的症状为疼痛、有的伴有肿胀。关节痛是许多自身免疫性风湿病（又名结缔组织病）共有症状，也是一个致人不安的症状，有必要探索其原发病而予以治疗，同时必须给予镇痛药对症治疗。在病因（如外伤）或原发病未能控制时亦应给以镇痛药治疗。

7.1.1.2 类风湿关节炎及其药物治疗

类风湿关节炎（rheumatoid arthritis RA）累及多个关节的慢性炎症性自身免疫病。其主要症状为对称性的小关节晨僵，肿痛，功能障碍，部分病人伴有低热、乏力、血管炎等。本病应在早期就进行合理治疗，否则必致骨破坏、关节畸形和功能丧失。

（1）用药目的和原则

①尽早应用抗风湿药以控制关节炎症，避免出现不可修复的骨破坏，防止关节畸形和功能障碍。诊断有困难的关节炎尽早转到有条件的医疗单位就诊。

②常用于治疗 RA 的非生物性疾病缓解的抗风湿药（DMARDs）有甲氨蝶呤(MTX)、来氟米特（LEF)、柳氮磺吡啶(SSZ)、羟氯喹或氯喹（HCQ 或 CQ)、雷公藤多苷。生物性 DMARDs 有 TNF 拮抗药、利妥昔单抗。

③ DMARDs 的选择和用法是依据于患者的病程、病情活动度、影响预后的指标来决定。DMARDs 可以联合或单独应用，宜尽早使用。并定期根据疾病活动度的变化来调整药物。

④非甾体抗炎药（NSAIDs)，糖皮质激素是控制关节肿痛症状为主。为对症或过渡期治疗的药物。

⑤这三类抗风湿药物各有不良反应，尤其是长期服用者，故宜定期(1 ~ 3 个月）监测血象、肝肾功能等有关项目，以保证服药安全性。

（2）治疗类风湿关节炎药物

①免疫抑制药，亦称疾病缓解抗风湿药，这类药物可以阻止 RA 的病情发展，但无根治作用。它们减轻 RA 的症状，有的有停止骨破坏的作用。

②非甾体抗炎药（nonsteroidal anti-inflammatory drugs，NSAIDs)，用于减轻关节炎病人的关节痛、肿的症状，起效较快，改善其生活质量。但不能控制病情进展，故需与免疫抑制药同时应用。

③糖皮质激素抗炎力强，可迅速控制关节肿痛症状。在某些关节炎患者可能起 DMARDs 样作用。应用不当时有较大不良反应。

④ TNF 拮抗药(tumor necrosis factor antagonist)是抑制 TNF(致炎性细胞因子)的靶向生物制剂。它对炎性关节症状、炎症指标的控制有较好作用。它亦有一定阻止骨破坏进展、甚或修复作用。然而它不根治 RA。目前它被列为生物性 DMARDs 类。

7.1.1.3 系统性红斑狼疮及其药物治疗

系统性红斑狼疮（systemic lupus erythematosus，SLE)是自身免疫介导的，以免疫性炎症反应为突出表现的弥漫性结缔组织病。

SLE 特征性的皮肤黏膜损害是蝶形红斑，光敏感、脱发、盘状红斑和口鼻黏膜溃疡等。SLE 常出现对称性多关节疼痛、肿胀，通常不引起骨质破坏。50% ~ 70% 的 SLE 出现狼疮性肾炎(lupus-nephritis，LN)，临床表现为蛋白尿，尿红细胞增多，晚期肾功能不全，它对预后影响大。此外，还有神经精神狼疮（neuropsychiatric lupus，NPSLE）或侵害呼吸系统、心脏、肠系膜等。

治疗 SLE 用药目的和原则如下。

①早期诊断和早期治疗，避免或延缓不可逆的组织脏器的病理损害。糖皮质激素和免疫抑制药物是治疗 SLE 的主要药物，选择时需权衡治疗的风险与效益之比，制定具体的治疗方案。

②轻型的 SLE，虽有狼疮活动，而无明显内脏损害者，药物治疗包括非甾体类抗炎药（NSAIDs）和抗疟药。抗疟药对减少病情的活动、减少激素的不良反应方面效果肯定。据病情可加用糖皮质激素。必要时考虑使用硫唑嘌呤、甲氨蝶呤等免疫抑制药。

③重型 SLE 的治疗分为诱导缓解和巩

固治疗两个阶段，诱导缓解目的在于迅速控制病情，阻止或逆转内脏损害，力求疾病迅速缓解。根据病情选用日≥1 mg/kg剂量的糖皮质激素及免疫抑制药如环磷酰胺并用。病情好转后再调整药物。维持治疗的目的是保持疾病的稳定，防止复燃。维持期糖皮质激素量减为一日≤10 mg，免疫抑制药也可调整剂量和类别。

④难治性狼疮可以选用B细胞清除生物制剂，利妥昔单抗（抗CD20抗体）治疗。

7.1.1.4 强直性脊柱炎及其药物治疗

强直性脊柱炎（ankylosing spondylitis，AS）是一种慢性炎症性疾病，主要侵犯脊柱和骶髂关节，临床上主要表现为炎性腰背痛或僵硬，部分患者可有外周关节炎、肌腱端炎、眼炎等表现。该病主要累及青壮年，疾病晚期出现脊柱强直、畸形和功能受限。有明显的家族聚集倾向，与HLA-B27强相关。确切病因不清楚。

AS的治疗包括教育、休息、适度的体能锻炼、非甾体类抗炎药和物理治疗。与RA相比，在疾病缓解抗风湿药物中，目前只有柳氮磺吡啶被证实对有外周关节受累的AS患者有一定的疗效，对中轴脊柱病变则效果不明显。目前显示，肿瘤坏死因子拮抗药对AS和其他脊柱关节病有效，然而它不具有改善AS骨韧带结构性病变的作用。

用药目的和原则如下。

①早期应用足量NSAIDs能够有效改善患者脊柱或外周关节疾病的疼痛和僵硬感，常用的NSAIDs包括传统的非选择和选择性COX-2抑制药。

②传统DMARDs疗效不肯定，且长期服用有不良作用。故不推荐使用。柳氮磺吡啶可能对AS外周关节炎有一定疗效。

③病情不能控制者，可应用生物制剂（TNF拮抗药）治疗。

④部分外周关节炎患者，可考虑关节腔内注射糖皮质激素。

7.1.1.5 银屑病关节炎及其药物治疗

银屑病关节炎（psoriatic arthritis，PsA），银屑病中有10%～30%患者的关节可以受累。所受累的关节部位有远端指（趾）间关节、脊柱、骶髂关节等，其轻重不一；部分患者可出现难以控制的、甚至残毁型的关节炎，导致严重残疾。

用药目的和原则如下。

① NSAIDs改善银屑病关节炎的关节及脊柱症状。

② DMARDs控制银屑病的关节炎和皮疹，阻止病情进展，包括甲氨蝶呤、来氟米特，两者可联合应用。

③对常规DMARDs疗效不佳的患者，可考虑应用生物制剂，TNF拮抗药。

④外周关节炎严重的患者，可考虑局部关节腔注射糖皮质激素治疗。不建议系统性用糖皮质激素治疗，因在停药引起严重复发。

7.1.1.6 多发性肌炎和皮肌炎及其药物治疗

多发性肌炎（polymyositis）、皮肌炎（dermatomyositis）均属非化脓性炎性肌病，有的尚伴有特征性皮肤改变的自身免疫病。它们都以对称性的近端肌无力，血清肌酶升高，肌电图出现肌源性损害（炎症和坏死）为其临床特征。常可累及肺脏。多发性肌炎指无皮肤损害的肌炎，伴有Gottron型皮疹的肌炎则称皮肌炎。

用药目的和原则如下。

①诊断明确后，尽早开始药物治疗。急性期以糖皮质激素作为首选用药。对病情反复及重症患者应及时联合应用免疫抑制药。

②大剂量静脉注射免疫球蛋白静脉滴注或血浆置换对部分重症患者有改善效果，但不能替代糖皮质激素或免疫抑制药。

③合并恶性肿瘤患者在切除肿瘤后，肌炎症状可自然缓解。

④监测药物不良反应，定期检查血常规、肝肾功能等指标，及时调整药物。

7.1.1.7 舍格伦综合征及其药物治疗

舍格伦综合征（Sjogren' s syndrome）是主要累及外分泌腺体、亦可累及其他组织的系统性自身免疫病。异常的免疫反应造成了舍格伦综合征患者泪腺和涎腺的破坏和功能异常，出现眼干、口干等症状。

许多患者的异常免疫反应还累及血液、肝、肾、肺等重要脏器，造成血细胞减少、小胆管炎、肾小管酸中毒、肺间质病变，病情严重者可危及生命。大约 5% 的患者可最终发展成为淋巴瘤。

用药目的和原则如下。

①对症治疗缓解口、眼干燥的症状。采用代替疗法，多用人工制成替代眼泪的滴眼药。保持口腔卫生。

②针对泪腺和涎腺功能下降可予以胆碱能受体激动药，增强分泌外分泌腺的功能，刺激唾液和泪液分泌。

③对本病造成的肾小管酸中毒应予补钾、纠正酸中毒治疗，病情严重者应予糖皮质激素和免疫抑制药。

④根据不同临床特点制定相应治疗方案，重要脏器如肺、血液、肝、神经受累时采用糖皮质激素及免疫抑制治疗。

⑤羟氯喹可缓慢降低本病高球蛋白血症，也可改善涎腺、泪腺功能。

7.1.1.8 系统性硬化及其药物治疗

系统性硬化（systemic sclerosis）是以皮肤组织间质和血管纤维化为基本病理改变的自身免疫病。疾病早期出现皮肤肿胀性反应，随后出现显著的皮肤的肿胀、硬化（失去弹性），继以萎缩。组织间质的纤维化也发生在心、肺、肾、胃肠道等内脏器官，造成其功能障碍。系统性硬化病变的严重程度和进展速度变化较大，对治疗的反应一般较差，脏器受累者预后很差。

用药目的和原则如下。

①积极减少雷诺现象发作，采用保暖、血管扩张药。控制肺动脉高压、肺间质纤维化等脏器损伤的进展。

②根据不同临床特点制定相应的治疗方案。出现肾皮质危象要尽早使用血管紧张素转换酶抑制药降压，改善肾功能。对于继发的肺间质纤维化可使用糖皮质激素和免疫抑制药，可能控制部分患者病情进展。

7.1.1.9 韦格纳肉芽肿及其药物治疗

韦格纳肉芽肿（Wegener's granulomatosis，WG）是以毛细血管、微小动静脉受累为主的系统性坏死性肉芽肿性血管炎。其典型临床特征为三联征，即上呼吸道、下呼吸道（肺）及肾脏病变。在不应用糖皮质激素和免疫抑制药的患者平均存活期为 5 个月，其 82% 的患者在 1 年内死亡；应用糖皮质激素和环磷酰胺联合治疗可明显地改善本病的预后。

用药目的和原则如下。

①其治疗又可分为诱导缓解、维持缓解以及控制复发。

②基本治疗药物是糖皮质激素和静脉输入环磷酰胺。

③只少数局限型的患者没有严重的内脏损害，可以仅使用小至中等剂量的糖皮质激素和甲氨蝶呤。

7.1.1.10 风湿热及其药物治疗

风湿热（rheumatic fever）是上呼吸道 A 组乙型溶血性链球菌感染后引起的一种免疫性疾病，可累及关节、心脏、皮肤，神经系统、血管等。心肌炎的反复发作可导致风湿性心脏病。本病多见于青少年。前驱症状表现为发热、咽痛、颌下淋巴结肿大等上呼吸道感染表现，2 ~ 6 周后出现典型表现如游走性多发性大关节炎、心肌炎、皮下结节、环形红斑、舞蹈病。

治疗目的及原则如下。

①消灭链球菌，去除病灶，并预防链球菌感染，以免风湿热的进展和复发。诊断后肌内注射青霉素或口服青霉素或红霉素（对青霉素过敏者）10 日。为预防链球菌感染则每 4 周肌内注射苄星青霉素或口服磺胺嘧啶或其他链球菌敏感的抗生素 1 周左右。

②抗炎治疗：口服阿司匹林，一日 3 ~ 6g，分 3 次服用；儿童一日 50 ~ 100 mg/kg，分次服用；疗程 2 ~ 4 周，以后递减。

③活动性心肌炎需用糖皮质激素治疗。

7.1.1.11 骨关节炎及其药物治疗

骨关节炎（osteoarthritis，OA）是最常见的关节病。好发于中年以后的慢性关节炎，其患病率随年龄增大而增加。多累及负重关节，如膝、髋、颈、腰椎及手

的小关节。本病起病缓慢，症状逐渐加重，主要表现为关节痛、晨僵（短暂），肿胀，受累关节骨性肥大、骨擦音及功能障碍，急性发作时可出现关节腔积液，重症患者出现关节畸形。

用药目的和原则如下。

①非药物治疗与药物治疗并重，前者包括减轻体重、物理治疗和增强关节和肌力的需氧锻炼等。

②使用最小有效量的 NSAIDs 控制患者症状。外用止痛药及关节腔内注射糖皮质激素或透明质酸均是据病情选择的治疗方法。

③软骨保护剂可降低基质金属蛋白酶、胶原酶等活性作用，既可抗炎止痛，又可保护关节软骨，延缓 OA 病情发展。现有氨基葡萄糖、双醋瑞因等。

7.1.2 风湿病用药

7.1.2.1 非甾体抗炎药

非甾体抗炎药是一大类化学结构式各异，但有共同的药理作用的药物。它们具有抗炎、对急性和慢性疼痛有良好的镇痛及解热作用；临床应用广泛，特别是炎性关节病、软组织风湿的常用药。

阿司匹林因所需用的治疗剂量可引起较多不良反应，除风湿热外，已极少用于关节痛（炎）。小剂量阿司匹林（一日 300 mg 以下）有独特的抑制血小板聚集作用，用于心脑血管事件的预防。（其他见 4.11.1）。

非甾体抗炎药应用时的注意事项如下。

① NSAIDs 只起改善镇痛、抗炎症状的作用，并不治疗原发病，因此在用 NSAIDs 同时须治疗原发病。

② NSAIDs 最常见的不良反应为胃肠道的不良反应，严重者出现胃肠溃疡、出血、甚至穿孔。不同化学结构的 NSAID 胃肠严重不良反应有差异。选择性 COX-2 抑制药的胃肠严重不良反应发生率低于传统（非选择性）NSAIDs。

③所有 NSAIDs 均可导致血压升高、钠潴留、水肿等。对服用者应进行相关检测。

④所有 NSAIDs 在长期连续服用后都可能出现发生率不高但严重的心血管栓塞事件与剂量及疗程呈正相关。

⑤ NSAIDs 与小剂量阿司匹林（保护心脏）同服用会增加胃肠道出血，必须用 NSAIDs 者应加服质子泵抑制药（PPI）或米索前列醇，或选用对乙酰氨基酚。

⑥布洛芬不宜与服用小剂量阿司匹林者同用，因通过相互作用会降低阿司匹林的心脏保护作用。其他传统 NSAIDs 也可能有此现象。选择性 NSAIDs 不影响阿司匹林的抗凝作用。

⑦不宜同时服用一种以上的 NSAIDs，因会增加其不良反应。

⑧结合患者具体情况选用 NSAIDs，如年龄，并存病（如心肌梗死、消化性溃疡史、出血史、高血压）、肝肾功能、心血管危险因子等。还要注意到即使同一种 NSAIDs，它对不同患者有不同疗效反应和不良反应。选药要个体化。

⑨任一种 NSAIDs 均应服用最低有效剂量，因为低剂量的安全性高。

布洛芬[基（基），保（甲／乙）]

Ibuprofen

【适应证】缓解各种慢性关节炎的关节肿痛症状；治疗各种软组织风湿性疼痛，如肩痛、腱鞘炎、滑囊炎、肌痛及运动后损伤性疼痛等；急性疼痛，如手术后、创伤后、劳损后、原发性痛经、牙痛、头痛等；有解热作用。

【注意事项】(1) 对阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏者对本品可有交叉过敏反应。(2) 本品可能增加胃肠道出血的风险并导致水钠潴留。(3) 轻度肾功能不全者可使用最小有效剂量并密切监测肾功能和水钠潴留情况。(4) 孕妇及哺乳期妇女尽量避免使用。(5) 避免本品与小剂量阿司匹林同用以防后者减效。(6) 有消化道溃疡病史、支气管哮喘、心功能不全、高血压、血友病或其他出血性疾病、有骨髓功能减退病史的患者慎用。(7) 长期用药时应定期检查血象及肝、肾功能。

【禁忌证】(1) 活动性消化性溃疡。(2) 对阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏者。(3) 服用此类药物诱发哮喘、鼻炎或荨麻疹患者。(4) 严重肝病患者及中重度肾功能不全者。

【不良反应】消化道症状包括消化不良、胃烧灼感、胃痛、恶心、呕吐。少见的为胃溃疡和消化道出血，以及头痛、嗜睡、晕眩、耳鸣、皮疹、支气管哮喘发作、肝酶升高、血压升高、白细胞计数减少、水肿等。罕见的为肾功能不全。

【用法与用量】(1) 成人，布洛芬片(胶囊)：①抗风湿，一次 0.4～0.6 g，一日 3～4 次，类风湿关节炎比骨关节炎用量大些；②轻中度疼痛，一次 0.2～0.4 g，4～6 小时 1 次。一日最大剂量为 2.4 g。缓释剂型：一次 0.3 g，一日 2 次。软膏：一日 3 次，外用。(2) 儿童用量：常释制剂，一次按体重 5～10 mg/kg，一日 3 次，口服。儿童日最大剂量为 2.0 g。

【制剂与规格】布洛芬片剂：① 0.1 g；② 0.2 g。

布洛芬胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g。

布洛芬缓释胶囊：0.3 g。

布洛芬口服液：10 ml：0.1 g。

布洛芬混悬液：100 ml：2 g。

布洛芬滴剂：15 ml：600 mg。

布洛芬软膏：每支 20 g。

洛索洛芬[保(乙)]

Loxoprofen

【适应证】(1) 类风湿关节炎、骨关节炎、腰痛症、肩关节周围炎、颈肩腕综合征等疾病的消炎和镇痛。(2) 手术后，外伤后及拔牙后的镇痛和消炎。(3) 急性上呼吸道炎（包括伴有急性支气管炎的急性上呼吸道炎）等疾病的解热和镇痛。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女用药应权衡利弊。(2) 哺乳期妇女用药时停止哺乳。(3) 以下情况慎用，如有消化性溃疡既往史患者，血液异常或有其既往史患者，肝损害或有其既往史患者，肾损害或有其既往史患者，心功能异常患者，有过敏症既往史患者，支气管哮喘患者，高龄者。(4) 长期用药时，应定期查尿常规、血常规及肝功能，若出现异常应减量或停止用药。(5) 用于急性疾病时，应考虑急性炎症、疼痛及发热程度给药；原则上避免长期使用同一药物。(6) 伴有高热的高龄者或合并消耗性疾患的患者，密切观察病情。(7) 用于感染引起的炎症时，应合用适当抗菌药，慎重给药。(8) 避免与其他 NSAIDs 合用。(9) 有长期使用非甾体抗炎药可导致女性暂时性的不育的报道。

【禁忌证】有消化性溃疡、严重血液学异常和肝肾功能损害、心功能不全者，对本品成分有过敏反应者、阿司匹林哮喘者、妊娠晚期妇女。

【不良反应】(1) 严重不良反应：休克、溶血性贫血、皮肤黏膜眼综合征、急性肾衰竭、肾病综合征、间质性肺炎、消化道出血、肝功能障碍、黄疸、哮喘发作。(2) 其他不良反应：皮疹、瘙痒感、荨麻疹、腹痛胃部不适感、食欲减退、恶心及呕吐、腹泻、便秘、胃灼热、口内炎、消化不良、嗜睡、头痛、贫血、白细胞计数减少、血小板减少、嗜酸粒细胞增加、肝酶升高、水肿、心悸、面部潮红。

【用法与用量】口服：不宜空腹服药。①用于前两类适应证时，成人一次 60 mg，一日 3 次。出现症状时，可一次性口服 60～120 mg，应随年龄及症状适宜增减或遵医嘱。②用于第三类适应证时，成人一次顿服 60 mg，应随年龄及症状适宜增减。但原则上一日 2 次，一日最大剂量不超过 180 mg，或遵医嘱。

【制剂与规格】洛索洛芬钠片：60 mg。

洛索洛芬钠胶囊：60 mg。

萘普生[保(乙)]

Naproxen

【适应证】用于类风湿关节炎、骨关节炎、强直性脊柱炎、急性痛风性关节炎、肌腱炎、腱鞘炎等的肿胀、疼痛、活动受限均有缓解症状作用。亦可用于缓解肌肉骨骼扭伤、挫伤、损伤及痛经等所致疼痛。

【注意事项】(1) 对阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏者对本品可有交叉过敏反应。(2) 本品有增加胃肠道出血的风险并导致水钠潴留。(3) 轻度肾功能不全者可使用最小有效剂量，并密切监测肾功能和水钠潴留情况。(4) 孕妇及哺乳期妇女尽量避免使用。(5) 有凝血机制或血小板功能障碍、哮喘、心功能不全或高血压者慎用。长期用药应定期进行肝肾功能、血象、血压及眼科检查。

【禁忌证】对本品或同类药品过敏者、

活动性消化性溃疡患者、严重肝肾功能不全者。

【不良反应】(1) 常见胃烧灼感、消化不良、胃痛或不适、恶心及呕吐，严重者有胃肠出血、甚至穿孔。(2) 久服者有血压升高、头晕、嗜睡、头痛等。(3) 少见视物模糊或视觉障碍、听力减退、腹泻、口腔刺激或痛感、心慌及多汗、下肢水肿、肾脏损害（过敏性肾炎、肾病、肾乳头坏死及肾衰竭等）、荨麻疹、过敏性皮疹、精神抑郁、肌肉无力、粒细胞减少及肝功损害等。

【用法与用量】(1) 口服：①抗风湿。成人，普通片一次 0.25 ~ 0.5 g，一日 2 次，必要时 6 ~ 8 小时 1 次，一日最大剂量 1.5 g。缓释剂型，一次 0.5 g，一日 1 次。儿童，普通片，按体重一日 10 mg/kg，分 2 次口服，一日最大剂量 750 mg。②止痛，成人，普通片，首次 0.5 g，必要时重复，以后一次 0.25 g，6 ~ 8 小时 1 次。疗程不超过 10 日。(2) 直肠给药：成人，一次 0.25 g，睡前肛内塞人。(3) 注射：①肌内注射，成人一次 100 ~ 200 mg，一日 1 次。②静脉注射，成人一次 0.275 g，一日 1 ~ 2 次，加氯化钠注射液 20 ml 稀释后缓慢注射，时间不得少于 3 分钟。儿童按体重 5 mg/kg 或遵医嘱。③静脉滴注，成人一次 0.275 g，一日 1 ~ 2 次，加氯化钠注射液 100 ml 稀释后缓慢滴注，时间不得少于 30 分钟。儿童按体重 5 ml/kg，或遵医嘱。

【制剂与规格】萘普生片：① 0.1 g；② 0.125 g；③ 0.25 g。

萘普生胶囊：0.25 g。

萘普生缓释胶囊：0.5 g。

萘普生注射液：① 2 ml : 0.1 g；② 2 ml : 0.2 g；③ 2 ml : 0.275 g（相当于萘普生 0.25 g）。

萘普生栓剂：0.25 g。

双氯芬酸 [基(基)，保(甲)]

Diclofenac

【适应证】用于各种急慢性关节炎和软组织风湿所致的疼痛，以及创伤后、术后的急性疼痛、牙痛、头痛等。对成年人和儿童的发热有解热作用。双氯芬酸钾起效迅速，可用于痛经及拔牙后止痛用。

【注意事项】(1) 本品可增加胃肠道出血的风险并导致水钠潴留，血压上升。(2) 轻度肾功能不全者可使用最小有效剂量并密切监测肾功能和水钠潴留情况。(3) 本品有使肝酶升高倾向，故使用期间宜监测肝功能。(4) 孕妇及哺乳期妇女尽量避免使用。(5) 胃肠道溃疡史者避免使用。有心功能不全病史、肝、肾功能损害和老年患者及服用利尿药或任何原因细胞外液丢失的患者慎用。(6) 有眩晕史或其他中枢神经疾病史的患者服用本品期间应禁止驾车或操纵机器。(7) 长期用药应定期进行肝肾功能、血象、血压监测。

【禁忌证】对本品或同类药品有过敏史、活动性消化性溃疡患者、中重度心血管病变者禁用。

【不良反应】常见上腹部疼痛及恶心、呕吐、腹泻、腹部痉挛、消化不良、腹部胀气、厌食。少见头痛、头晕、眩晕、皮疹、血清 AST 及 ALT 升高、血压升高。罕见过敏反应及水肿、胃肠道溃疡、出血、穿孔和出血性腹泻。

【用法与用量】(1) 肠溶片：成人，关节炎，一次 25 ~ 50 mg，一日 3 次；急性疼痛，首次 50 mg，以后 25 ~ 50 mg，6 ~ 8 小时 1 次。(2) 缓释胶囊：成人，关节炎，一次 75 ~ 100 mg，一日 1 ~ 2 次。一日最大剂量为 150 mg。(3) 小儿常用量：肠溶片，一日 0.5 ~ 2 mg/kg，一日最大量为 3 mg/kg，分 3 次服。(4) 栓剂直肠给药：成人，一次 50 mg，一日 50 ~ 100 mg。肛门塞入。(5) 乳胶剂：外用，一日 3 次。

【制剂与规格】双氯芬酸钠肠溶片：① 25 mg；② 50 mg。

双氯芬酸钠缓释胶囊：① 50 mg；② 100 mg。

双氯芬酸钠二乙胺盐乳胶剂：20 g。

双氯芬酸钠栓剂：① 50 mg；② 100 mg。

双氯芬酸钾片：25 mg。

氟芬那酸 [保(乙)]

Flufenamic Acid

【适应证】用于风湿性及类风湿关节炎及痛经，分娩后疼痛等。

【注意事项】肾功能不全、哮喘患者慎用。

【禁忌证】对本药及非甾体类抗炎镇痛药过敏者禁用。消化性溃疡患者、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】恶心、呕吐、腹泻等。偶有皮疹、眩晕、白细胞减少、ALT及AST升高、血尿、蛋白尿及水肿。

【用法与用量】口服：一次0.2～0.3g，一日3次，饭后或睡前服用。

【制剂与规格】氟芬那酸胶囊：0.2g。

吲哚美辛[基(基)，保(甲)]

Indometacin

【适应证】用于缓解轻、中、重度风湿病的炎症疼痛及急性骨骼肌肉损伤、急性痛风性关节炎、痛经等的疼痛。亦用高热的对症解热。

【注意事项】(1) 消化性溃疡、溃疡性结肠炎及其他上消化道疾病病史者慎用。(2) 癫痫、帕金森病和精神病患者，使用后可使病情加重。(3) 本品能导致水钠潴留，心功能不全及高血压患者应慎用。(4) 本品经肝脏代谢，肾脏排泄，对肝肾均有一定毒性，肝、肾功能不全时应慎用。(5) 本品可使出血时间延长，加重出血倾向，故血友病及其他出血性疾病患者应慎用。(6) 本品对造血系统有抑制作用，再生障碍性贫血、粒细胞减少等患者慎用。(7) 长期用药注意定期检查血压、肝肾功能和血象并定期做眼科检查。(8) 有直肠炎和出血者，应避免直肠给药。(9) 老年人易发生毒性反应，应慎用。

【禁忌证】对阿司匹林及其他非甾体抗炎药过敏者、上消化道出血或活动性消化性溃疡及溃疡性结肠炎的患者和孕妇和哺乳期妇女、有血管性水肿和支气管哮喘者。

【不良反应】常见胃肠道消化不良、腹泻、严重者上消化道出血和溃疡；神经系统，如头痛、头晕、焦虑和失眠等。少见血压升高、困倦、意识模糊、失眠、惊厥、精神行为障碍、抑郁、晕厥；影响血三系，如白细胞计数或血小板减少，甚至再生障碍性贫血；血尿、水肿、肾功能不全；各型皮疹过敏反应、哮喘、休克。偶有肠道狭窄。直肠用药有可能导致直肠激惹和出血。

【用法与用量】(1) 成人口服：①抗风湿，首次剂量一次25～50mg，一日2～3次，饭时或餐后立即服，一日最大量不超过150mg。关节炎患者如有持续性夜间疼痛或晨起时关节发作，可在睡前给予本品栓剂50～100mg，塞入肛门。②抗痛风，首次剂量一次25～50mg，继之25mg，一日3次，直到疼痛缓解，可停药。③痛经，一次25mg，一日3次。④退热，口服，一次12.5～25mg，一日不超过3次。(2) 成人直肠给药：一日50～100mg，睡前塞入肛门内。(3) 口服与直肠联合用药：一日最大剂量150～200mg。

【制剂与规格】吲哚美辛胶囊：25mg。

吲哚美辛缓释胶囊：30mg。

吲哚美辛控释胶囊：①25mg；②75mg。

吲哚美辛栓剂：①25mg；②50mg；③100mg。

吲哚美辛乳膏：1%。

美洛昔康[保(乙)]

Meloxicam

【适应证】用于慢性关节病，包括缓解急慢性脊柱关节病、类风湿关节炎、骨性关节炎等的疼痛、肿胀及软组织炎性、创伤性疼痛、手术后疼痛。

【注意事项】本品出现胃肠道溃疡和出血风险略低于其他传统NSAIDs。服用时宜从最小有效剂量开始。有消化性溃疡史者慎用。服药者定期检查其肝肾功能，尤其是65岁以上老年患者。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女、对本品过敏者、对使用阿司匹林或其他非甾体类抗炎药物后出现哮喘、鼻腔息肉、血管水肿或荨麻疹者、活动性消化性溃疡或消化性溃疡出血者、严重肝功能不全者、非透析性严重肾功能不全者、胃肠道出血、脑出血或其他出血和严重心力衰竭者均禁用。

【不良反应】常见贫血、轻微头晕、头痛、消化不良、恶心、呕吐、腹痛、便秘、

胀气、腹泻、瘙痒、皮疹、肝酶短暂升高，停药即消失。少见白细胞计数减少、血小板减少、粒细胞缺乏、眩晕、耳鸣、嗜睡、心悸、胃肠道出血、消化性溃疡、食管炎、口炎、短暂肝肾功能轻度异常、荨麻疹。罕见过敏样反应、哮喘发作、胃炎、结肠炎、消化性溃疡、穿孔或胃肠道出血、肝炎、Stevens-Johnson 综合征和中毒性表皮坏死松解症、血管性水肿、多形红斑和感光过敏及肾衰竭等。

【用法与用量】(1) 口服：①骨关节炎，一日 7.5 mg，一次性服用，一日最大剂量为 15 mg；②强直性脊柱炎和类风湿关节炎，一日 15 mg，分 2 次服用，也可减量至一日 7.5 mg。成人一日最大剂量为 15 mg，老年人一日 7.5 mg。(2) 直肠给药：骨关节炎 7.5 ~ 15 mg，睡前肛内塞入；类风湿关节炎和强直性脊柱炎 15 mg 或 7.5 mg，睡前肛内塞入。老年人 7.5 mg，睡前肛内塞入。(3) 15 岁以下儿童不推荐使用。

【制剂与规格】美洛昔康片：7.5 mg。美洛昔康栓：15 mg。

氯诺昔康[保(乙)]

Lornoxicam

【适应证】用于急性轻度至中度疼痛和由某些类型的风湿性疾病引起的关节疼痛和炎症。

【注意事项】以下情况慎用，如肝、肾功能受损者，有胃肠道出血或十二指肠溃疡病史者，凝血障碍者，老年人及哮喘患者。

【禁忌证】已知对非甾体类抗炎药（如阿司匹林）过敏者、由水杨酸诱发的支气管哮喘者、急性胃肠出血或急性胃或肠溃疡者、严重心功能不全者、严重肝功能不全者、血小板计数明显减低者、妊娠和哺乳期妇女、年龄 < 18 岁者。

【不良反应】常见头晕、头痛、胃肠功能障碍（如胃痛、腹泻、消化不良、恶心和呕吐）。

【用法与用量】口服：(1) 急性轻度或中度疼痛，一日 8 ~ 16 mg。如需反复用药，一日最大剂量为 16 mg。(2) 风湿性疾病引起的关节疼痛和炎症，一日剂量为 12 ~ 16 mg。

【制剂与规格】氯诺昔康片：8 mg。

萘丁美酮[保(乙)]

Nabumetone

【适应证】用于骨关节炎、类风湿关节炎、强直性脊柱炎的关节肿痛和脊柱痛的对症治疗。亦用于软组织风湿病、运动性软组织损伤及手术后、外伤后等止痛。

【注意事项】(1) 对阿司匹林过敏者对本品可能有相似反应。(2) 具有消化性溃疡病史的患者使用后，应对其症状进行定期检查。(3) 肾功能损害的患者，应考虑减少剂量或禁用。(4) 有心力衰竭、水肿或高血压的患者应慎用本品。(5) 在餐中服用本品可使吸收率增加，应在餐后或晚间服用。服用本品的剂量一日超过 2 g 时腹泻发生率增加。(6) 老年人用本品应该维持最低有效剂量。

【禁忌证】活动性消化性溃疡或出血、严重肝功能异常、对本品及其他非甾体类药物过敏者禁用，孕妇和哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 较常见：①胃肠道，如恶心、呕吐、消化不良、腹痛、腹泻、便秘、胃肠胀气、大便隐血试验阳性、胃炎、口干和口腔炎、上消化道出血；②神经系统，如头痛、头晕、疲劳、耳鸣、多汗、失眠、多梦、嗜睡和紧张；③皮肤，如皮疹和瘙痒及皮肤水肿。(2) 少见：黄疸、食欲增加或减退、吞咽困难、肠胃炎、肝功能异常、大便隐血试验阳性、肝衰竭、衰弱、兴奋、焦虑、多疑、抑郁、震颤和眩晕、大疱性皮疹、荨麻疹、光敏感、风疹、中毒性表皮坏死松解症、多形性红斑、Stevens-Johnson 综合征、血管炎、体重增加、呼吸困难、过敏性肺炎、蛋白尿、氮质血症、高尿酸血症、肾病综合征、阴道出血、血管神经性水肿。(3) 罕见：胆红素尿、十二指肠炎、嗳气、胆结石、舌炎、胰腺炎和直肠出血；噩梦、味觉异常、脱发、心绞痛、心律失常、高血压、心肌梗死、心悸、晕厥、血栓性静脉炎、哮喘和咳嗽、排尿困难、血尿、阳痿和肾结石、发热、寒战、贫血、白细胞计数减少、粒细胞减少症、血糖升高、低钾血症和体重减轻。

【用法与用量】口服：成人，每晚1 g，一次性服用。一日最大量为2 g，分2次服。老年人每晚0.5 g，一次性服用。儿童不推荐使用。

【制剂与规格】萘丁美酮片：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 0.75 g。

萘丁美酮胶囊：0.25 g。

塞来昔布[保(乙)]

Celecoxib

【适应证】缓解骨关节炎、类风湿关节炎、强直性脊柱炎的肿痛症状，也用于缓解手术前后、软组织创伤等的急性疼痛。

【注意事项】(1) 本品属非甾类抗炎药中选择性COX-2抑制药类。它导致胃肠黏膜损伤而引起消化性溃疡和出血的风险较其他传统非甾体抗炎药为少。适用于有消化性溃疡、肠道溃疡、胃肠道出血病史者。(2) 本品有引起心血管栓塞事件的风险，且与剂量及疗程（1年以上连续服用）相关。有心血管风险者慎用。(3) 本品的心血管栓塞事件的风险与其他传统NSAIDs相似。(4) 本品长期服用可引起血压升高、水钠潴留、水肿等。故长期服用宜监测血压、血象、肝肾功能。(5) 本品化学结构中一个芳基为苯磺酰胺，故与磺胺类药有交叉过敏反应，因此在使用本品前要询问患者是否对磺胺类药过敏。(6) 有支气管哮喘病史、过敏性鼻炎、荨麻疹病史者慎用。(7) 有中度肝肾损害者，本品剂量应减低而慎用。(8) 服用本品时不能停服因防治心血管病所需服用的小剂量阿司匹林，但两者同服会增加胃肠道不良反应。

【禁忌证】对磺胺过敏者、对阿司匹林或其他非甾体类抗炎药物过敏或诱发哮喘者及对本品过敏者、有心肌梗死史或脑卒中史者、严重心功能不全者及重度肝功能损害、孕妇及哺乳期妇女均禁用本品。

【不良反应】(1) 常见胃肠胀气、腹痛、腹泻、消化不良、咽炎、鼻窦炎；由于水钠潴留可出现下肢水肿、头痛、头晕、嗜睡、失眠。(2) 少见口炎、便秘、心悸、疲乏、四肢麻木、肌肉痉挛、血压升高。(3) 偶见ALT、AST升高。(4) 罕见味觉异常、脱发。(5) 非常罕见癫痫恶化。

【用法与用量】口服：①骨关节炎，一日200 mg，一次性服用，如有必要，可增加剂量。最大剂量为一次200 mg，一日2次，儿童不推荐使用。②类风湿关节炎及强直性脊柱炎，可增加到一次200 mg，一日1～2次，儿童不推荐使用。③急性疼痛：首剂400 mg，必要时可再服200 mg，随后根据需要，一日2次，一次200 mg。

【制剂与规格】塞来昔布胶囊：① 100 mg；② 200 mg。

对乙酰氨基酚[基(基)，保(甲/乙)]

Paracetamol

【适应证】用于中、重度发热。缓解轻度至中度疼痛，如头痛、肌痛、关节痛等的对症治疗。为轻中度骨关节炎的首选药物。

【注意事项】(1) 对阿司匹林过敏者，一般对本品不发生过敏反应，但有报告在因阿司匹林过敏发生哮喘的患者中，少数（< 5%）可于服用本品后发生轻度支气管痉挛性反应。(2) 肝病者尽量避免长期使用。(3) 肾功能不全者长期大量使用本品有增加肾脏毒性的危险，故建议减量使用。(4) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(5) 3岁以下儿童因其肝、肾功能发育不全慎用。(6) 长期大剂量用药应定期进行肝肾功能和血象检查。(7) 不宜大量或长期用药以防引起造血系统和肝肾功能损害。

【禁忌证】严重肝肾功能不全患者及对本品过敏者禁用。

【不良反应】常规剂量下的不良反应很少，少见恶心、呕吐、出汗、腹痛、皮肤苍白等；罕见过敏性皮炎（皮疹、皮肤瘙痒等）、粒细胞缺乏、血小板减少、高铁血红蛋白血症、贫血、肝肾功能损害和胃肠道出血等。

【用法与用量】(1) 退热镇痛：口服。①成人，一次0.3～0.6 g，一日3～4次；一日量不超过2 g，退热疗程一般不超过3日，镇痛不宜超过10日。②儿童，按体重一次10～15 mg/kg，4～6小时1次。或按体表面积一日1.5 g/m^2，分次服，每4～6小时1次；12岁以下的小儿每24小时不超过5次量。解热用药一般不超过3日，镇痛遵医嘱。(2) 骨关节炎：成人常用量，口服缓释片，一次0.65～1.3 g，

8小时1次。一日最大量不超过4g，疗程按医嘱。

【制剂与规格】对乙酰氨基酚片：①0.1g；②0.3g；③0.5g。

对乙酰氨基酚控释片：0.65g。

对乙酰氨基酚混悬液：15ml：1.5g。

复方阿司匹林片：每片含阿司匹林226.8mg，咖啡因35mg，对乙酰氨基酚126mg。用于发热、头痛、神经痛、牙痛等。口服：成人，一次1～2片，一日3～4次。

复方对乙酰氨基酚片：每片含对乙酰氨基酚0.13g、阿司匹林0.2g、咖啡因0.035g。用于发热、头痛、神经痛、牙痛等。口服：成人，一次1～2片，一日3～4次。

氨酸双氢可待因（双氢可待因－对乙酰氨基酚）片：每片含双氢可待因酒石酸盐10mg、对乙酰氨基酚500mg。用于各种剧烈咳嗽和多种疼痛、感冒引起的头痛、发热、咳嗽。口服：每4～6小时服1～2片，日剂量最大为8片。12岁以上儿童服法同成人。

复方丙氧氨酚片：每片含无水萘磺酸右丙氧芬50mg，对乙酰氨基酚250mg。本品具有中等程度的镇痛效应。临床用于治疗神经性疼痛，手术后痛，牙痛、血管性头痛，骨关节痛、二线脱瘾及各种中轻度癌性疼痛等，但不宜长期持续服用。口服：成人一次1～2片，一日3～4次，餐后服，儿童酌减或遵医嘱。7岁以下儿童不宜使用。

7.1.2.2　糖皮质激素

糖皮质激素（glucocorticoids或corticosteroids，以下简称激素），具有强大的抗炎作用和一定的免疫抑制作用，是治疗许多自身免疫病的基础药。临床用药强调个体化，即其剂量、用药方法、疗程取决于疾病种类、病情活动性和严重性和个体的情况及其并存的其他病。在治疗过程中应同时或适时加用其他免疫抑制药，以便更快地诱导病情缓解和巩固疗效，并避免因长期使用较大剂量激素导致严重的不良反应。在用法上差异甚大如在系统性红斑狼疮（SLE）活动期或有重要脏器累及，乃至出现狼疮危象或其他重症结缔组织病（如系统性血管炎、炎性肌病等），都可以使用大剂量激素冲击治疗。必要时与免疫抑制药联合应用，一可加速起效，二可改善预后，三可减少部分激素剂量。凡病情稳定后宜用最小维持量，以泼尼松为标准，一日不超过7.5mg。

糖皮质激素根据其在人体内排出时限，分为短、中、长效不同的制剂。如无特殊，在结缔组织病中多采用短、中效制剂，即泼尼松、泼尼松龙、甲泼尼龙（口服及静滴）、可的松，只有在局部用药（如关节腔内注射、蛛网膜下腔注射）时可考虑长效激素。

糖皮质激素虽有良好的治疗弥漫性结缔组织病作用，但其不良反应亦众多。长期服用会出现库欣综合征的面部表现，血压及血糖升高，对细菌、真菌、病毒易感、促使结核复发，股骨头坏死，儿童生长发育受抑等；因此在使用前要有足够指征并筛查患者情况，必要时先给予对并存症治疗，如控制感染、降压、降糖药。应用激素过程中要密切随诊可能出现不良反应。不良反应应多与剂量平行，故据病情宜采用最低的有效治疗量。

糖皮质激素的适应证为：全身或局部用于过敏性及自身免疫性炎症性疾病，如泼尼松或泼尼松龙用于系统性红斑狼疮、多肌炎／皮肌炎、血管炎、类风湿关节炎、严重支气管哮喘、肾病综合征、血小板减少性紫癜等系统性自身免疫病。局部注射地塞米松或倍他米松有抗炎和缓解疼痛作用。用于各类慢性关节炎，急性扭伤、肩周炎、腱鞘炎、滑囊炎、慢性腰腿痛。（其他见5.4.4）

泼尼松龙　用于过敏性、自身免疫性炎症性疾病，成人开始按病情轻重，口服一日量15～40mg，需要时可达60mg，或一日0.5～1mg/kg，发热患者分3次服，体温正常者一日晨起一次顿服。病情稳定后应逐渐减量，维持量5～10mg，视病情而定。肌内注射或关节腔注射，一日10～40mg，必要时可加量（其他见5.4.4.2）。

泼尼松[基(基)]　见5.4.4.2。

氢化可的松[基(基)] SLE及系统性血管炎急性期或不宜口服药者。静脉滴注，一日300 mg，疗程3～5日，根据病情减药量或改口服。SLE脑病：鞘内注射，一次1 ml（25 mg），一周1次，3次为1个疗程。骨关节炎：关节腔内注射，一次2ml。（其他见5.4.4.2）

甲泼尼龙 冲击疗法，用于严重自身免疫性炎症性疾病和（或）对常规治疗无反应的疾病。如系统性红斑狼疮。一日1 g，静脉给药，连用1、2、3日。因大剂量可引起心律失常，因此仅限在医院内使用本治疗方法，以便及时处理。一次给药应至少120分钟，如果治疗2～3周后病情无好转，或因病情需要，本治疗方案可重复。静脉给药，初始剂量从40 mg到50 mg不等，依临床疾病而变化。静脉用药数日后，必须逐步减量或改为口服给药。口服给药，不同疾病甲泼尼龙片的初始剂量可一日4～48 mg调整。用法同泼尼松。（其他见5.4.4.2）

曲安奈德 关节腔、囊内、腱鞘内注射剂量依据于病情严重程度和病灶部位大小，成人小面积给药10 mg，大面积给药40 mg即可有效减轻症状。用药次数视症状缓解情况而定。（其他见5.4.4.2）

地塞米松[基(基)] 静脉滴注，一次2～20 mg；静脉滴注时，应以5%葡萄糖注射液稀释，可2～6小时重复给药，至病情稳定。大剂量连续给药一般不超72小时。不宜长期应用。鞘内注射一次5 mg，间隔1～3周注射一次；关节腔内注射一般一次0.8～4 mg，按关节腔大小而定。口服，成人开始剂量为一次0.75～3 mg，一日2～4次。维持量为一日0.7～1.5 mg，视病情而定。（其他见5.4.4.2）

倍他米松 ①复方倍他米松注射液，每支1 ml，含倍他米松磷酸酯二钠2 mg、二丙酸倍他米松5 mg。肌内注射：全身给药时，开始为1～2 ml，必要时可重复给药，剂量及注射次数视病情和患者反应而定。关节内注射：局部注射剂量为0.25～2.0 ml（视关节大小或注射部位而定）。大关节（膝、髋、肩）用1～2 ml，中关节（肘、腕、踝）用0.5～1 ml，小关节（足、手、胸）用0.25～0.5 ml。②倍他米松磷酸钠注射液，1 ml：5.26 mg（相当于倍他米松4 mg）。肌内或静脉注射，一日2～20 mg，分次给药。

7.1.2.3 免疫抑制药

免疫抑制药（immunosuppressive drugs）的结构相异，但具共同特性，即可以抑制免疫反应过程中的某一成分，利用其抑制淋巴细胞的生成及增殖以达到免疫抑制作用，从而阻断免疫反应的进展，以达到治疗效果。

在20世纪由于器官移植治疗的开展，为抑制不同器官移植后的排斥反应，在采用抗排斥的治疗方案中免疫抑制药是主体。几十年来相继出现了多种免疫抑制药，如环孢素、吗替麦考酚酯、他克莫司、雷公藤多苷等，预计将有更多新药出现。免疫抑制药亦成为治疗自身免疫病不可少的药物。以类风湿关节炎（自身免疫病之一）为例，免疫抑制药不仅可以改善其临床症状，尚能延缓其软骨、骨的破坏，减少关节的致残并保持其功能。在类风湿关节炎的治疗指南中称本类药物为改变病情的抗风湿药（DMARDs）。其应用原则是尽早用、联合用（即一个以上的DMARDs同时用），根据病情轻重选用不同的DMARDs组合。在其他多系统的自身免疫病，如系统性红斑狼疮、皮肌炎/多肌炎、血管炎等，免疫抑制药是除糖皮质激素外的关键药物，它们可以改善患者的预后，延长其生存期。

现用于各种风湿病的免疫抑制药只有少数是已经为国家批准的。这是因为它们中不少是市场上的“老药”，原是为抗肿瘤或抗移植反应的，它们经风湿领域医药人员大量实践和总结，调整其剂量和用法，其中许多在国外已被批准用于各种风湿病的治疗。

较突出的有甲氨蝶呤（MTX）不仅被欧美国家批准用于类风湿关节炎的治疗，并在我国类风湿关节炎的诊治指南中成为首选的治疗药物。

环磷酰胺（CTX）在系统性红斑狼疮的指南中是治疗重症系统性红斑狼疮、狼疮肾炎、狼疮脑病、血管炎的关键性药物。

另有一些 DMARDs 在风湿病中扩大了国家批准的适应证，如羟氯喹用于系统性红斑狼疮、舍格伦综合征、类风湿关节炎的治疗（批准适应证为盘状红斑狼疮）。柳氮磺吡啶用于强直性脊柱炎的周围关节病（批准适应证为类风湿关节炎）。循证医学证明这些药物在治疗相应的风湿病是合理且有效的，安全性是可以接受的。从疗效和经济观点来讲它们是值得继续应用的。虽然生物制剂（如 TNF 拮抗药）已进入 DMARDs 的行列，它们的疗效很被认可，安全性不比传统 DMARDs 差，可惜价格昂贵。因此我国风湿患者仍将依赖于上述传统 DMARDs。本类药物有不少的不良作用，轻者为胃肠道不适、脱发、重者有感染、肝肾功能损害、骨髓抑制、停经、胎儿致畸等。不良作用与剂量及疗程相关。需在医师的指导下服用，定期随诊监测相关指标，根据个体情况调整药物剂量及种类。

甲氨蝶呤[保（甲）]

Methotrexate

【适应证】类风湿关节炎、银屑病及银屑病关节炎、强直性脊柱炎的周围关节炎。

【注意事项】(1) 本品是治疗类风湿关节炎的标准药，有大量临床资料证明它对类风湿关节炎的有效性和安全性。(2) 治疗银屑病关节炎(包括银屑病皮损)有疗效。(3) 低剂量，一周 7.5 ~ 15 mg，未见有明显细胞毒作用。(4) 接受本品治疗过程中可出现肝酶上升，若肝酶上升到正常值 3 倍，需停药。至停药后 4 周内肝酶可恢复。(5) 中重度肾功能不全者慎用。(6) 长期服用出现感染的机会增多。(7) 本品可导致周围血白细胞计数和（或）血小板减少，轻者停药恢复，严重者骨髓受抑。(8) 因其对胎儿有致畸作用故应停药 3 个月以上方可考虑生育。(9) 服用本品者禁酒，初始时每月查血象及肝肾功能，逐渐过渡到每 3 个月检测 1 次。

【禁忌证】【不良反应】见 10.3.1.2。

【用法与用量】(1) 类风湿关节炎：口服，一周 1 次，7.5 ~ 15 mg，最高剂量一周 1 次 25 mg。胃肠道症状严重者可皮下注射。与其他免疫抑制药合用时一周量可减。(2) 银屑病关节炎：口服，一周 1 次，15 ~ 20 mg。(3) 强直性脊柱炎的周围关节炎：口服，一周 1 次，7.5 ~ 10 mg。

【制剂与规格】甲氨蝶呤片剂：2.5 mg。注射用甲氨蝶呤粉针剂：5 mg。

环磷酰胺[保（甲）]

Cyclophosphamide

【适应证】活动性系统性红斑狼疮、狼疮肾炎、精神神经性狼疮、系统性血管炎。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如周围血白细胞计数和（或）血小板低下、骨髓抑制、感染尚未控制、肝肾功能损害、痛风病史、泌尿道结石史、放化疗病史。(2) 本品的代谢产物对泌尿系统有刺激性，为预防肾及膀胱毒性，应鼓励患者用药后大量饮水，必要时静脉补液，也可给予尿路保护剂美司钠 (3) 用药期间定期监测血尿常规、肝肾功能和血清尿酸水平。(4) 环磷酰胺水溶液仅能稳定 2 ~ 3 小时，需现用现配。(5) 一次静脉滴注前需查血常规。白细胞计数 $< 3.0 \times 10^9/L$ 或血小板 $< 50.0 \times 10^9/L$ 者停用。

【禁忌证】白细胞计数和（或）血小板低下者、肝肾功能中重度损害者、对本品过敏者禁用。妊娠妇女(本品有致突变、致畸作用，可造成胎儿死亡或先天畸形）与哺乳期妇女（本品可由乳汁排出）禁用。

【不良反应】(1) 心血管系统，本品常规剂量不产生心脏毒性，大剂量（120 ~ 240 mg/kg）可能引起出血性心肌坏死（包括病灶部位出血、冠状血管炎等），甚至在停药后 2 周仍可出现心力衰竭。(2) 胃肠道，可有食欲减退、恶心、呕吐，停药后 2～3 日可消失。也可见口腔炎。(3) 肝脏，可造成肝脏损害，因本品的主要代谢物丙烯醛具肝毒性，引起肝细胞坏死、肝小叶中心充血，并伴 AST 及 ALT 升高。(4) 泌尿生殖系统，大剂量给药时，本品

的代谢产物丙烯醛可以引起肾出血、膀胱纤维化及出血性膀胱炎、肾盂积水、膀胱尿道反流。用于白血病或淋巴瘤治疗时，易发生高尿酸血症及尿酸性肾病。此外，本品可引起生殖毒性，如停经或精子缺乏。(5) 呼吸系统，偶有肺纤维化，个别报道有肺炎。(6) 皮肤，可有皮肤及指甲色素沉着、黏膜溃疡、荨麻疹、脱发、药物性皮炎。偶见指甲脱落。(7) 可有视物模糊。(8) 长期使用本品可致继发性肿瘤。(9) 本品对骨髓抑制的严重程度与使用剂量相关。白细胞计数多于给药后 10 ～ 14 日达最低值，停药后 21 日左右恢复正常，血小板减少比其他烷化剂少见。(10) 代谢／内分泌系统，大剂量给药（50 mg/kg）并同时给予大量液体时，可产生水中毒。(11) 其他。用药后偶见发热、过敏反应。

【用法与用量】(1) 成人常用量：①活动性系统性红斑狼疮、狼疮肾炎：静脉注射，按体表面积一次 500 ～ 1 000 mg/m^2，3 ～ 4 周 1 次；或静脉注射一次 200 mg，隔日 1 次，疗程约 6 个月，以后 3 个月 1 次。口服，一日 100 mg，一次性服用，维持期量减半。疗程遵医嘱。②系统性血管炎活动期：静脉注射，一次 200 mg，一日或隔日 1 次。疗程遵医嘱。(2) 儿童常用量：口服，一日 1～3 mg/kg。

【制剂与规格】环磷酰胺片：50 mg。

复方环磷酰胺片：环磷酰胺 50 mg、人参茎叶总皂苷：50 mg。

注射用环磷酰胺粉针剂：① 0.1 g；② 0.2 g；③ 0.5 g。

硫唑嘌呤[基(基)、保(甲)]

Azathioprine

【适应证】用于系统性红斑狼疮，皮肌炎，系统性血管炎及其他自身免疫性结缔组织病及难治性特发性血小板减少性紫癜。

【注意事项】(1) 周围全血细胞计数检查以监测骨髓抑制征象，监测频率在最初服用时，需 4 周 1 次，之后可减少至 3 个月 1 次。大剂量用药和肝肾功能损伤患者可增加监测频率，出现出血、感染、肝功能损伤时应立即减量或停药。(2) 原有肝肾功能不全患者或老年人降低用药剂量。(3) 准备妊娠的妇女及哺乳期妇女不宜使用。(4) 发生非霍奇金淋巴瘤、皮肤癌、肉瘤和原位子宫颈癌的危险性增加。

【禁忌证】对硫唑嘌呤和巯嘌呤过敏者，妊娠或准备妊娠的妇女及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 生殖系统：对精子、卵子亦有一定的损伤，使用时应注意。(2) 消化系统：厌食、恶心、呕吐等常见。偶可致胰腺炎。肝脏毒性亦较常见，用药后，患者可见肝中心及小叶静脉消失，出现黄疸、肝大、腹痛、腹水、肝性脑病、胆汁淤积、AST 及 ALT 升高、肝实质细胞坏死、肝细胞纤维化、肝硬化等。(3) 血液：可出现白细胞计数及血小板减少、巨红细胞血症、贫血。大剂量及用药过久时可有严重骨髓抑制，甚至出现再生障碍性贫血。(4) 其他：可继发感染、脱发、黏膜溃疡、腹膜出血、视网膜出血、肺水肿等。另外，长期用药可增加风湿病患者发生肿瘤的危险性。

【用法与用量】口服：①用于自身免疫性疾病：成人常用量，一次 100 mg，一日 1 次。病情缓解后一次 50 mg，一日 1 次。小儿常用量，一次按体重 1 ～ 3 mg/kg，一日 1 次。②用于难治性特发性血小板减少性紫癜：一日 1～3 mg/kg，一次或分次服用，有效后酌减。

【制剂与规格】硫唑嘌呤片：① 50 mg；② 100 mg。

来氟米特[保(乙)]

Leflunomide

【适应证】用于类风湿关节炎，减缓骨质破坏，减轻症状和体征。

【注意事项】(1) 本品可抑制骨髓，可出现周围血白细胞计数减少，停药后可恢复。(2)本品可导致 ALT 及 AST 升高，停药后可恢复。(3) 本品可引起胃肠反应，与药物剂量相关。(4) 本品有致畸作用。(5) 应用本品期间不宜使用免疫活疫苗。(6) 拟生育者必须停药 3 个月以上。(7) 免疫缺陷、未控制感染、活动性胃肠道疾病、肾功能不全、骨髓发育不良者不宜用本品。有高血压患者在用药过程中应监测血压。(8) 用药期间检测肝功能、血象，1 ～ 3 个月一次。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠及哺

乳期妇女、拟在近期内生育者、肝肾功能重度不全者。

【不良反应】(1) 胃肠道：口腔溃疡、消化不良、恶心、呕吐、腹泻，腹泻严重者宜停药。(2) 肝 AST 及 ALT 升高达正常值 3 倍者宜停药，低于 3 倍则减量。(3) 血白细胞计数下降下降至 3.0×10^9/L 时宜停药，$3.0 \sim 3.5 \times 10^9$/L 则减量。(4) 其他：脱发、乏力、血压升高、头晕、皮疹、瘙痒、呼吸道感染。

【用法与用量】口服：①成人常用量，一日 20 ~ 50 mg，一次性口服，连续 3 日后，维持量一日 10 ~ 20 mg，一次性口服。②儿童常用量，国内产品尚未建立。国外产品如下，体重 < 20 kg，10 mg，隔日一次；20 ~ 40 kg，10 mg，一日 1 次；> 40 kg，同成人量。

【制剂与规格】来氟米特片：10 mg。

雷公藤多苷[基(基)，保(甲)]

Tripterygium Glycosides

【适应证】用于类风湿关节炎、银屑病关节炎、系统性红斑狼疮、肾病综合征。

【注意事项】(1) 本品影响生育功能，对男女均有影响，故服此药时应避孕。拟生育者必须停药 3 个月以上。(2) 对各种风湿性疾病，应用本品必须在医师指导下进行。(3) 老年患者应适当减量，儿童慎用。(4) 在用本品过程中应定期监测血象和肝肾功能，必要时停药。

【禁忌证】孕妇及哺乳期妇女、严重心血管病、肝肾和造血系统病变和功能障碍者。

【不良反应】(1) 生殖系统：本品可致女性月经减少，停经。对高龄妇女可致绝经。对男性可致精子活力降低，数量减少，停药后部分人群可恢复正常。(2) 消化系统：可引起恶心、呕吐、腹痛、腹泻、食欲减退等症状，一般能耐受。(3) 皮肤黏膜：发生皮肤黏膜反应较多见。可出现皮肤变薄、色素沉着、皮疹、口腔溃疡、痤疮、指甲变薄。(4) 血液系统：有骨髓抑制作用，可引起白细胞计数及血小板减少，但少见。(5) 其他：偶引起心悸、胸闷、心律失常、AST 及 ALT 升高、肾肌酐清除率下降。少部分患者可引起头晕、头痛、失眠、脱发等。

【用法与用量】口服：成人正常量一日 60 mg，分 3 次餐后口服。控制症状后减量。维持量一日 20 ~ 30 mg，分次口服。

【制剂与规格】雷公藤多苷片：10 mg。

白芍总苷

Total Glucosides of Paeony

【适应证】用于类风湿关节炎。

【注意事项】少数患者服药初期出现大便性状改变，可小剂量开始，一次 0.2 g，一日 2 次，1 周后加到常规量。

【禁忌证】对白芍及其相关成分过敏者禁用。

【不良反应】偶有软便，大便次数增多，不需处理，可自行消失。其他可少见腹胀、腹痛、食欲减退、恶心和头晕等。

【用法与用量】口服：①成人一次 0.6 g，一日 2 ~ 3 次，餐后用水冲服，或遵医嘱。4 周为 1 个疗程，连服 2 ~ 3 个疗程效更佳。建议首期 3 个月，一次 0.6 g，一日 3 次，起效后一次 0.6 g，一日 2 次，维持。②儿童推荐用量，一日按体重 30 mg/kg，分 2 次早晚服。

【制剂与规格】白芍总苷胶囊：0.3 g（含芍药苷不少于 104 mg）。

羟氯喹

Hydroxychloroquine

氯喹[基(基)]

Chloroquine

【适应证】用于盘状红斑狼疮、系统性红斑狼疮伴皮损和（或）关节病变、类风湿关节炎、青少年慢性关节炎舍格伦综合征以及由阳光引发或加剧的皮肤病变。

【注意事项】(1) 长期应用可致视网膜黄斑病变，发生率很低，氯喹服用者较羟氯喹更多见。因此在连续服用 1 年者应做眼底及视野筛查，视网膜病变与超剂量服用有关。(2) 本品引起葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G-6-PD）缺乏者溶血性贫血。(3) 羟氯喹有降低血糖作用，有助于糖尿病控制。(4) 吸烟可影响抗疟药的疗效。

【禁忌证】(1) 对任何 4-氨基喹啉化合物治疗而有视网膜或视野改变的患者。(2) 眼睛有黄斑病变的患者。(3) 已知对

4-氨基喹啉化合物过敏的患者和银屑病患者。(4) 孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 口服可能出现较轻消化道反应，包括食欲减退、恶心、呕吐、腹痛、腹泻，停药或不停药均可自行消失。(2) 久服后可能出现眼黄斑水肿、萎缩、异常色素沉着。检眼镜可见视力减退，影响视力，发生率约0.1%。其他罕见眼底反应有视盘萎缩及视网膜小动脉变细。(3) 氯喹影响听力，妊娠妇女大量服用可造成儿童先天性耳聋、智力迟钝、四肢缺陷等。(4) 氯喹偶可导致心律失常。(5) 其他如血细胞减少、皮炎、皮肤色素沉着、脱发、药物性精神异常均较罕见。

【用法与用量】口服：用于治疗红斑狼疮或类风湿关节炎。①成人，氯喹，开始一次0.25 g，一日1～2次或一日3.5～4 mg/kg，一次性服用。经过2～3周后可改为一日1次，一次0.25 g，长期维持。羟氯喹，一日0.2～0.4 g，分1～2次服用，或一日≤6 mg/kg分次服。疗程持续数周或数月。长期维持治疗一日0.2 g。②儿童，氯喹，按体重，一日5～10 mg/kg，一次或分次服用。羟氯喹，一日5～7 mg/kg，分次服用。

【制剂与规格】磷酸氯喹片：0.25 g。
硫酸羟氯喹片：① 0.1 g，② 0.2 g。
(其他见9.8.1.8)

柳氮磺吡啶 用于类风湿关节炎、强直性脊柱炎的外周关节病、银屑病关节炎。口服：①成人起始量一日500 mg，分2次口服，一周递增至一日1.5～3.0 g，分2～3次服用。②儿童一次7.5～10 mg/kg，一日4次。初始剂量一日10 mg/kg；逐渐递增至一日规定量。一日最大量为2g，分次服。(其他见3.5.1)

环孢素 常与糖皮质激素等免疫抑制药合用，以治疗难治性或重症自身免疫性结缔组织病、类风湿关节炎等。口服：用于自身免疫病，初始剂量为一日3～5 mg/kg，分2次口服，出现明显疗效后缓慢减至一日2～3 mg/kg，疗程3～6个月以上。(其他见8.8)

吗替麦考酚酯 用于难治性狼疮肾炎、不能耐受其他免疫抑制药或有严重器官损害的（弥漫性）结缔组织病。口服：①用于狼疮肾炎，成人一次1 g，一日2次。一日2 g比一日3 g的安全性明显高。对有严重慢性肾功能损害的患者（肾小球滤过率每分钟＜25 ml），应避免超过一次1 g，一日2次的剂量。②结缔组织病，成人一次0.75～1 g，一日2次。维持量，一次0.25～0.5 g，一日2次，空腹服用。(其他见8.8)

青霉胺[保(甲)]

Penicillamine

【适应证】用于系统性硬化患者的皮肤肿胀和硬化、类风湿关节炎。

【注意事项】(1) 对青霉素过敏者，也可能对本品交叉过敏。(2) 本品对肝肾及血液系统均有不良影响，宜密切观察。(3) 65岁以上的老年人用药后易出现血液系统毒性反应。(4) 药物对哺乳的影响。尚不明确本品是否可分泌入人类乳汁，建议哺乳期妇女服药期间停止哺乳。(5) 用药前后及用药时应当检查或监测。在开始服药的6个月内，应每2周检查1次血尿常规，以后每月检查1次。治疗期间应每1～2个月检查肝肾功能1次，以便早期发现中毒性肝病和胆汁淤留及肾损伤。

【禁忌证】对本品过敏者、孕妇禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应：可出现全身瘙痒、皮疹、荨麻疹、发热、关节疼痛和淋巴结肿大等过敏反应。重者可发生狼疮样红斑和剥脱性皮炎。(2) 消化系统：可有恶心、呕吐、食欲减退、腹痛、腹泻、味觉减退、口腔溃疡、舌炎、牙龈炎及溃疡病复发等。少数患者出现肝功异常(AST及ALT升高)。(3) 泌尿生殖系统：部分患者出现蛋白尿，少数患者可出现肾病综合征。(4) 血液系统：可致骨髓抑制，主要表现为血小板和白细胞计数减少、粒细胞缺乏，严重者可出现再生障碍性贫血。也可见嗜酸粒细胞增多、溶血性贫血。(5) 神经系统：可有眼睑下垂、斜视、动眼神经麻痹等。少数患者在用药初期可出现周围神经病变。长期服用可引起视神经

炎。(6) 内分泌代谢系统：本品可与多种金属形成和复合物，可能导致铜、铁、锌或其他微量元素的缺乏。(7) 呼吸系统：可能加重或诱发哮喘发作。

【用法与用量】口服：初始剂量一次0.125 g，一日1次，逐渐加至一日0.75～1 g，分3次服。常规维持量为0.25 g。

【制剂与规格】青霉胺片：① 125 mg；② 250 mg。

青霉胺胶囊：① 125 mg；② 250 mg。

金诺芬片

Auranofin

【适应证】用于类风湿关节炎，控制活动性，保持其病情稳定。

【注意事项】(1) 本品起效慢，疗效判定需在服药后至少3个月。(2) 本品作用不强，现较少单独用于治疗类风湿关节炎，必要时与另一缓解病情的抗风湿药并用。(3) 本品在治疗前和疗程中定期（1～3个月）监测血尿常规及肝肾功能。

【禁忌证】对金诺芬片有过敏反应、坏死性小肠结肠炎，肺纤维化，剥脱性皮炎，骨髓再生障碍，进行性肾病，严重肝病和其他血液系统疾病。孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 常见腹泻、稀便，偶见有腹痛、恶心或其他胃肠道不适，通常较轻微短暂，无需停药。必要时可用对症治疗。(2) 其他常见皮疹、瘙痒，严重的皮疹需停药。偶见口腔炎、结膜炎、肾病综合征。(3) 有资料显示，少数患者在用药期间可出现白细胞计数和血小板数下降、紫癜、纯红细胞性再生障碍性贫血、肝肾功能异常。

【用法与用量】口服：一日6 mg，一日1次或分2次餐后服用。或初始剂量一次3 mg，一日1次，2周后增至一日6 mg，分2次服，服用6个月后，如餐后疗效不显著，剂量可增加至9 mg，分3次服用；一日9 mg连服3个月，效果仍不显著者应停药，病情稳定者维持剂量为一日3～6 mg。

【制剂与规格】金诺芬片：3 mg。

沙利度胺[保(乙)]

Thalidomide

【适应证】用于强直性脊柱炎、皮肤黏膜血管炎。

【注意事项】(1) 原用于治疗麻风病和血液系统肿瘤，目前小范围材料证明对强直性脊柱炎有控制病情的作用。(2) 本品致畸作用强，用药期间应该严格采取有效避孕措施以防止胎儿畸形。(3) 一旦出现手足末端麻木和（或）感觉异常，应立即停药。(4) 驾驶员和机器操纵者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 孕妇及哺乳期妇女、儿童。

【不良反应】口鼻黏膜干燥、头晕、倦怠、嗜睡、恶心、腹痛、便秘、面部水肿、面部红斑、过敏反应及多发性周围神经炎、深静脉血栓。

【用法与用量】口服：睡前一次50 mg，1周后递增至一日150 mg，分2～3次服用或睡前服。

【制剂与规格】沙利度胺片：① 25 mg；② 50 mg。

7.1.2.4 生物制剂

抗风湿病的生物制剂（biologic agents）始于1998年，它是一种针对并干扰疾病机制中某单一成分的靶向治疗。肿瘤坏死因子（TNF α）拮抗药控制RA炎症反应，阻止其疾病发展过程。对强直性脊柱炎、银屑病关节炎亦有效。它属DMARDs。TNF α 拮抗药的安全性主要在它使小部分原有陈旧结核灶者复发或发生新的结核病，亦增加患者对其他病原体的易感性，尤其是原有慢性感染性疾病者，如支气管扩张。对活动性乙型病毒肝炎患者的肝损害有加重之势并激活该病毒，因此对上述患者在应用前及应用过程中必须采取预防措施和严密观察。

TNF α 拮抗药共有3类：①英夫利昔单抗（Infliximab），一种人鼠嵌合的TNF单抗；②依那西普（Etanercept），是全人可溶性受体融合蛋白；③阿达木单抗（Adalimumab），是全人重组TNF α 单抗即将上市。三者的适应证、疗效和安全性基本相似。利妥昔单抗（Rituximab）

是抑制B淋巴细胞的靶向生物制剂。原用于B淋巴细胞肿瘤，目前试用于难治性或危重的系统性红斑狼疮或血管炎，或TNFα 拮抗药无效的RA。

依那西普

Etanercept

【适应证】用于活动性类风湿关节炎，银屑病及银屑病关节炎，幼年特发性关节炎，活动性强直性脊柱炎。

【注意事项】(1) 本品有诱发感染，患者有反复发作的感染史，尤其是老年者，使用本品时应慎重。(2) 在使用过程中患者出现感染，应及时停药并密切观察。(3) 在使用过程中，应注意过敏反应的发生，包括血管性水肿、荨麻疹以及其他严重反应，根据其情况给予抗过敏药物或停药。(4) 使用本品期间不可接种活疫苗。(5) 本品曾导致充血性心力衰竭的患者病情恶化，因此，重度心力衰竭患者不宜使用本品。(6) 治疗前要接受结核感染筛查（皮肤试验、胸部X线透视），对有结核感染或感染可疑者应首先抗结核治疗3个月，再考虑用本品治疗。(7) 治疗前要筛查乙型及丙型病毒感染，有活动性者不宜应用本品。(8) 在治疗类风湿关节炎时宜与甲氨蝶呤联合应用以提高疗效。

【禁忌证】感染、活动性结核病患者、对本品或制剂中成分过敏者禁用。孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】常见注射部位局部反应，包括轻至中度红斑、瘙痒、疼痛和肿胀等，注射部位反应通常发生在开始治疗的第1个月内，在随后的治疗中发生频率降低。注射部位反应平均持续3～5日。在临床试验中出现的其他不良反应包括头痛、眩晕、皮疹、咳嗽、腹痛、白细胞计数减少、中性粒细胞减少、鼻炎、发热、关节酸痛、肌肉酸痛、困倦、面部肿胀、面部过敏、肝功能异常、肾结石、肺纤维化等。

【用法与用量】皮下注射：①成人推荐剂量，一次25 mg，一周2次，注射部位可为大腿、腹部和上臂。②儿童推荐剂量，一周400 μg/kg，最大剂量为50 mg，分次皮下注射。

【制剂与规格】注射用依那西普：12.5 mg。

英夫利西单抗

Infliximab

【适应证】用于活动性类风湿关节炎，活动性强直性脊柱炎，银屑病及银屑病关节炎。

【注意事项】(1) 感染：接受本品的患者对各种感染，尤其分枝杆菌感染包括结核病菌较为易感，宜密切注意。已有感染者不宜应用。(2) 在使用本品前，做结核菌皮肤试验及胸部X线片的筛查试验。有陈旧性结核病复发或新感染的患者应首先抗结核治疗2～3个月。对结核病既往病史且不能确定已接受足够治疗疗程的患者必要时进行抗结核病治疗。(3) 充血性心力衰竭者不宜使用本品。(4) 输液反应／过敏反应：本品的过敏反应可在不同的时间内发生，多数出现在输液过程中或输液后2小时内，症状包括荨麻疹、呼吸困难和（或）支气管痉挛（罕见）、喉头水肿、咽部水肿和低血压。为减少输液反应的发生，应将输液速度放慢，或预防性使用对乙酰氨基酚或糖皮质激素。(5) 使用本品会促使自身抗体的形成，罕见的有狼疮样综合征。若有出现宜停药。(6) 神经系统：本品及其他TNFα 抑制药有罕见的中枢神经系统脱髓鞘病例。罕见视神经炎和癫痫发作的病例，出现上述症状不宜使用。(7) 使用本品的乙肝病毒及丙肝病毒慢性携带者有出现肝功能异常的风险。有活动性肝炎者不宜使用。(8) 所有TNFα 抑制药与淋巴瘤的相关性尚在观察中，目前尚无定论。(9) 用本品治疗类风湿关节炎时需与甲氨蝶呤联合应用，以提高疗效，亦减少不良反应。

【禁忌证】已知对鼠源蛋白或本品其他成分过敏的患者，患有中、重度心力衰竭（纽约心脏学会标准Ⅲ／Ⅳ级）的患者、有严重感染、活动性结核病患者，妊娠期及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 输液反应，输液中和输液结束后的2小时内，约有3%出现发热或寒战等非特异性症状，低于1%出现瘙痒或荨麻疹，罕见过敏性休克。所有发生上述反应的患者均全部恢复。(2) 感

染，本品增加机会性感染或感染加重的风险，并可促使潜伏性结核病复发或播散。(3) 使乙型或丙型病毒肝炎复活动。(4)可能增加淋巴瘤的发生。(5)可加重中、重度（纽约心脏学会标准Ⅲ／Ⅳ级）心力衰竭者的心功能不全。

【用法与用量】静脉滴注：①类风湿关节炎，首次 3 mg/kg，加入氯化钠注射液 200 ml，第 2 周和第 6 周及以后每隔 8 周各给予一次相同剂量。疗效不理想者，可考虑将本品剂量调整至 10 mg/kg，或将用药间隔调整为 4 周或 6 周。②强直性脊柱炎，首次 5 mg/kg，加入氯化钠注射液 200 ml，然后第 2 周和第 6 周及以后每隔 6 周各给予一次相同剂量。

【制剂与规格】注射用英夫利西单抗：100 mg。

利妥昔单抗

Rituximab

【适应证】用于难治性系统性红斑狼疮、经 TNF α 拮抗药治疗无效的类风湿关节炎。

【注意事项】(1) 置于无菌无致热源的含 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液的输液袋中，稀释到利妥昔单抗的浓度为 1 mg/ml。轻柔地颠倒注射袋使溶液混合并避免产生泡沫。由于本品不含抗微生物的防腐剂或抑菌制剂，必须检查无菌技术。静脉使用前应观察注射液有无微粒或变色。(2) 一次滴注利妥昔单抗开始前 30 ~ 60 分钟前应预先使用镇痛药（如对乙酰氨基酚）、抗组胺药（如苯海拉明）或糖皮质激素。(3) 对出现严重反应的患者，特别是有严重呼吸困难，支气管痉挛和低氧血症的患者应立即停止滴注，并迅速进行抢救治疗。

【禁忌证】已知对本品的任何组分和鼠蛋白过敏的患者。

【不良反应】(1) 输液相关不良反应主要包括轻微的流感样反应、发热、畏寒和寒战，其他症状有脸部潮红、血管性水肿、荨麻疹／皮疹、头痛、咽喉刺激、鼻炎、恶心、呕吐，约 10% 的病例有低血压和支气管痉挛。偶尔会出现原有的心脏疾病如心绞痛和心力衰竭的加重。偶可出现呼吸衰竭和急性肾衰竭等多器官功能衰竭。(2) 血液学不良反应包括严重的血小板减少症（1.3%）、严重的中性粒细胞减少症（1.9%）和严重的贫血（1.0%）。(3) 感染机会增多。包括严重的细菌感染、病毒感染和真菌感染。(4) 心脏不良反应有心律失常、直立性低血压、滴注期间有心绞痛和心肌梗死病史的患者中出现了心肌梗死。(5) 消化系统有腹泻、消化不良和厌食症。(6) 神经系统有头晕、焦虑、感觉异常、感觉过敏、易激惹、失眠和脱髓鞘病变。

【用法与用量】静脉滴注：成人推荐量，按体表面积 375 mg/m^2，一周静脉滴注 1 次，在 22 日内使用 4 次。1 000 mg 静脉滴注，2 周后重复。初次滴注推荐起始滴注速度为每小时 50 mg，最初 60 分钟过后，可每 30 分钟增加每小时 50 mg，直至最大速度每小时 400 mg。利妥昔单抗滴注的开始速度可为每小时 100 mg，每 30 分钟增加每小时 100 mg，直至最大速度每小时 400 mg。

【制剂与规格】利妥昔单抗注射液：① 10 ml：100 mg；② 50 ml：500 mg。

7.1.2.5 软骨保护药

本类药物能降低软骨基质中的金属蛋白酶、胶原酶等活性，有保护软骨作用，延缓骨关节病的发展。

玻璃酸钠（透明质酸钠）

Sodium Hyaluronate

【适应证】用于骨关节炎、膝关节炎、肩周炎、髋及踝关节炎。

【注意事项】(1) 本品为软骨保护药。使用时要严格按照无菌操作以避免继发感染。(2) 本品勿与其他药物混杂以免产生不良反应。(3)注射前行 X 线片协助诊断，以抽取关节液为鉴别诊断方法。(4) 有关节积液患者在注入前应先将积液抽出，再缓慢注入本品。(5) 勿将药物注入滑模和韧带内，以防增加疼痛，勿过深刺入以免损伤关节软骨。不得将药物注射到血管中。(6) 注射后嘱患者屈伸膝骨关节 10 次，使药物充分分布于软骨和滑膜表面，然后走动，嘱患者当日莫过量运动。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 个别患者注射部位可出现疼痛、肿胀、发热等症状，少数情况下出现非感染性关节腔积液，一般 2 ~ 3 日可自行消失，若症状持续不退，需应用抗生素治疗并停止用药，进行必要的处理。(2) 过敏反应，罕见有皮疹、荨麻疹、瘙痒等症状发生，一旦发生这些症状应立即停药并采取适当措施。

【用法与用量】用于膝关节骨关节炎时，膝关节腔内注射，用于肩周炎时，肩关节腔或肩峰：滑囊内注射。一次 2 ml，关节腔内注射，一周 1 次，3 周或 5 周为 1 个疗程。因产品不同而疗程有差异。

【制剂与规格】玻璃酸钠注射液：① 2 ml : 20 mg；② 2.5 ml : 25 mg。

氨基葡萄糖[保(乙)]

Glucosamine

【适应证】用于原发性和继发性各部位的骨关节炎。

【注意事项】有严重肝、肾功能不全者慎用。妊娠初期 3 个月内妇女应避免使用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】少见为轻度的胃肠不适，如恶心、便秘、腹胀和腹泻；偶见轻度嗜睡；罕见过敏反应，包括皮疹、瘙痒和皮肤红斑。

【用法与用量】口服：一次 0.25 ~ 0.5 g（硫酸氨基葡萄糖），一日 3 次，最好在进食时服用。持续服用 4 ~ 12 周或根据需要延长。每年可重复治疗 2 ~ 3 个疗程。

【制剂与规格】硫酸氨基葡萄糖胶囊：0.25 g。

盐酸氨基葡萄糖胶囊：0.24 g。

双醋瑞因

Diacerein

【适应证】用于骨关节炎。

【注意事项】(1) 严重肾功能不全者应减小剂量。(2) 有腹泻史者慎用。(3) 孕妇及哺乳期不推荐使用。(4) 餐后服用可以提高吸收率。服用 2 ~ 4 周后开始显效，建议显效前与其他止痛药或非甾体抗炎药联合应用。若连续治疗 3 个月后停药，疗效至少可持续 1 个月（后续效应）。(5) 15 岁以下儿童避免使用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见轻度腹泻，多数情况下会随着继续治疗或减小剂量而自动消失。少见的为上腹疼痛和恶心或呕吐。

【用法与用量】口服：一次 50 mg，一日 1～2 次，餐后服用。疗程不应短于 3 个月。

【制剂与规格】双醋瑞因胶囊：50 mg。

7.2 痛风及其用药

痛风（gout）是嘌呤代谢异常所致的一组疾病，其特征是尿酸盐结晶在关节或其他结缔组织中沉积，临床表现包括急性或慢性痛风性关节炎、痛风性肾病、尿酸性肾结石、痛风石等和高尿酸血症。

用药目的和原则如下。

(1) 急性痛风性关节炎，以控制关节炎的症状（红、肿、痛）为目的。常用药有非甾体抗炎药（阿司匹林及水杨酸钠禁用）和秋水仙碱。如上述两类药效果差或不宜用时可考虑用糖皮质激素。

(2) 高血尿酸治疗。痛风性关节炎症状基本控制后 2 ~ 3 周开始采取降血尿酸措施。目的是预防急性关节炎复发，导致关节骨破坏，肾结石形成。降血尿酸药物有抑制尿酸生成的别嘌醇和促使尿酸通过肾脏排出的苯溴马隆及丙磺舒。

(3) 非药物治疗，如禁酒、饮食控制、生活调节极为重要。如能遵照可避免或减少口服降尿酸药的许多不良反应和应用剂量。

(4) 抗痛风治疗是终身的。

(5) 无症状的高尿血症不一定需要治疗。

秋水仙碱[基(基)，保(甲)]

Colchicine

【适应证】用于急性期痛风性关节炎、短期预防痛风性关节炎急性发作

【注意事项】(1) 由于本品治疗痛风时的疗效和风险认识尚不一致，故选用本品时应慎重。(2) 老年人、胃肠道疾病、心功能不全及肝肾功能有潜在损害者应减

少剂量或慎用。(3)用本品治疗急性痛风，每1个疗程间应停药3日，以免发生蓄积中毒，尽量避免静脉注射或口服长期给药，即使痛风发作期也不要静脉注射与口服并用。(4)痛风关节炎症状控制后可继续减量，短程与降血尿酸联用以防痛风复发。(5)用药期间应定期检测血象及肝肾功能。

【禁忌证】(1)孕妇及哺乳期妇女。(2)对本品过敏者。(3)对骨髓增生低下及肝肾功能中重度不全者。

【不良反应】(1)常见恶心、呕吐、腹痛、腹泻，药物过量也可以引起严重腹泻、胃肠道出血、皮疹和肝肾损害。(2)少见周围神经炎、肌病、脱发、精子生成受抑制、休克、血尿、抽搐及意识障碍，死亡率高，多见于静脉用药及老年人。(3)长期应用有导致骨髓抑制的可能。

【用法与用量】口服：①急性期，初始剂量1 mg，之后一次0.5 mg，一日3次，最多每4小时一次，直至疼痛缓解，或出现呕吐或腹泻，24小时内最大剂量6 mg；3日内不得重复此疗程。另一方案为一次1 mg，一日3次，1周后剂量减半，疗程为2～3周。②预防痛风，一次0.5 mg，一日2次。疗程酌定，并注意不良反应的出现，如出现应随时停药。

【制剂与规格】秋水仙碱片：①0.5 mg；②1 mg。

别嘌醇[基(基)，保(甲/乙)]

Allopurinol

【适应证】用于具有痛风史的高尿酸血症、预防痛风关节炎的复发。

【注意事项】(1)同时应用秋水仙碱或非甾体类抗炎药(非阿司匹林或水杨酸类药)预防痛风性关节炎急性发作，直到高尿酸血症被纠正1个月后。(2)确保摄入充足的水分(一日2～3 L)，并维持尿液显性或微碱性，以减少尿酸石及肾内尿酸沉积的危险。(3)对于肿瘤化疗相关的高尿酸血症，别嘌醇的治疗应该在肿瘤化疗前开始。(4)肝肾功能不全者、老年人应慎用，并减少一日用量。(5)用药前及用药期间要定期检查血尿酸性及24小时尿酸水平，以此作用调整药物剂量的依据。(6)用药期间应定期检查血象及肝肾功能。(7)无症状的高尿酸血症不宜用本品。

【禁忌证】痛风性关节炎急性期；已经应用本品者则继续应用，同时另行治疗关节炎急性发作。

【不良反应】发生率为2%～5%，其中有些患者需停药，停药后一般能恢复正常，其不良反应表现如下：(1)皮肤：皮疹(常为斑丘疹)、皮肤瘙痒或荨麻疹等较常见。重症则可能发生其他过敏反应，如剥脱性皮炎、紫癜性病变、多形性红斑、Stevens-Johnson综合征和中毒性上皮坏死溶解。(2)胃肠道反应：恶心、呕吐、腹泻、胃痛及阵发性腹痛、胃纳减退、口腔溃疡等。(3)神经系统：周围神经炎，如手足麻木、刺痛或疼痛等，发生率＜1%。头痛、眩晕、嗜睡、视觉和味觉障碍等。(4)血液系统：白细胞计数减少、血小板减少或贫血，少见。但不论出现一条或几条明显减少，或骨髓抑制都应停药。(5)其他：脱发、发热、淋巴结肿大、男性乳腺发育、高血压、肝毒性、间质性肾炎及过敏性血管炎等。

【用法与用量】口服：成人，初始剂量一日100 mg顿服，之后根据血、尿尿酸水平调整剂量，国内常用最大剂量为一日300 mg，分2次或分3次口服，宜餐后服用，国外一日最大剂量600 mg，分3次服用，维持剂量通常一日100～200 mg。

【制剂与规格】别嘌醇片：100 mg。

丙磺舒[保(乙)]

Probenecid

【适应证】(1)高尿酸血症伴慢性痛风性关节炎及痛风石，但必须为：①肾小球滤过滤率大于每分钟50～60 ml；②无肾结石或肾结石史；③非酸性尿；④不服用水杨酸类药物者。(2)作为抗生素治疗的辅助用药，与青霉素、氨苄西林、苯唑西林、邻氯西林、萘夫西林等抗生素同时应用时，可抑制这些抗生素的排出，提高血药浓度并能维持较长时间。

【注意事项】(1)下述人员不宜服用本品：老年患者、肝肾功能不全者、活动性消化性溃疡或病史及肾结石者等。(2)痛风性关节炎急性发作症状尚未控制时不用

本品；如在本品治疗期间有急性发作，可继续应用原来的用量，同时给予秋水仙碱或其他非甾体抗炎药治疗。(3) 服用本品时应保持摄入足量水分（一日 2 500 ml 左右），以防止形成肾结石，必要时同时服用碱化尿液的药物。(4) 治疗痛风性关节炎，如患者有轻度肾功能不全，而 24 小时尿酸排泄量又未超过 700 mg，一般单日剂量不超过 2 g。(5) 用本品期间不宜服水杨酸类制剂。(6) 定期检测血和尿 pH、肝肾功能及血尿酸和尿尿酸等。(7) 根据临床表现、血和尿尿酸水平调整药物用量，原则上以最小有效量维持较长时间。(8) 老年患者因肾功能减退，用量酌减。

【禁忌证】(1) 对本品及磺胺类药过敏者。(2) 肾功能不全者。(3) 伴有肿瘤的高尿酸血症者，或使用细胞毒的抗癌药、放射治疗患者，均不宜使用本品，因可引起急性肾病。孕妇及哺乳期妇女禁用，2 岁以下儿童禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道症状，如恶心或呕吐等，见于约 5% 的服用者。偶可引起消化性溃疡。(2) 能促进肾结石形成，应保证尿 pH 为 6.0 ~ 6.5。大量饮水并同服碱化尿液的药物，以防肾结石。(3) 本品与磺胺出现交叉过敏反应，包括皮疹、皮肤瘙痒及发热等，但少见。(4) 偶引起白细胞减少、骨髓抑制及肝坏死等少见不良反应。

【用法与用量】口服：(1) 慢性痛风的高尿酸血症：成人，一次 0.25 g，一日 2 次，1 周后可增至一次 0.5 g，一日 2 次。(2) 增强青霉素类的作用：成人一次 0.5 g，一日 4 次。2 ~ 14 岁或体重在 50 kg 以下儿童，首剂 0.025 g/kg 或 0.7 g/m²，以后每次 0.01 g/kg 或 0.3 g/m²，一日 4 次。

【制剂与规格】丙磺舒片：① 0.25 g；② 0.5 g。

苯溴马隆 [保（乙）]

Benzbromarone

【适应证】用于具痛风史的高尿酸血症，慢性痛风性关节炎或痛风石伴有高尿酸血症者。

【注意事项】(1) 同时应用秋水仙碱或非甾体类抗炎药（非阿司匹林或水杨酸类药）预防痛风性关节炎急性发作，直到高尿酸血症被纠正至少 1 个月后。(2) 确保摄入充足的水分（一日 2 ~ 3 L），碱化尿液，维持尿液是中性或微碱性，防止发生肾结石。(3) 服用者需有正常的肾功能。在用药过程定期检测肾功能及血和尿尿酸的变化和血象。(4) 在用药期间，如果痛风发作，建议将所用药量减半，必要时服用秋水仙碱或吲哚美辛等非甾体抗炎药。(5) 用药期间出现持续性腹泻，应立即停药。

【禁忌证】痛风性关节炎急性发作期（单独应用）；有中、重度肾功能损害或肾结石；孕妇及哺乳期妇女；对本品过敏者。

【不良反应】可见恶心、腹部不适、肾结石、肾绞痛、诱发痛风性关节炎急性发作；少见发热、皮疹、肝肾功能损害等。

【用法与用量】口服：初始剂量一日 25 mg，之后根据血清尿酸或尿尿酸浓度调整剂量，无不良反应可渐增至一日 100 mg，宜餐后服用。服药 1 ~ 3 周查血清及尿尿酸浓度，视病情而定维持量，连用 3 ~ 6 个月。根据尿液 pH 决定是否口服碳酸氢钠。

【制剂与规格】苯溴马隆胶囊：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

7.3 骨科疾病及其用药

骨科疾病主要分为急性创伤、慢性劳损、骨病及骨肿瘤四大部分。本章重点介绍运动系统慢性损伤和骨病的药物治疗的有关内容。骨肿瘤治疗药见 10.3。

7.3.1 运动系统慢性损伤及其用药

运动系统慢性损伤可分为以下四类：①软组织慢性损伤，如肌、筋膜、肌腱、腱鞘、韧带和滑囊的慢性损伤，常见疾病有腰肌劳损、滑囊炎、肌腱炎、肩关节周围炎等。②骨慢性损伤，主要指在骨结构较纤细及易产生应力集中部位的疲劳性骨折。③软骨慢性损伤，包括关节软骨及骨骺软骨的慢性损伤，如髌骨软骨软化症和胫骨结节骨软骨病。④周围神经卡压伤。

药物治疗原则有：(1) 正确、合理的使用糖皮质激素，如醋酸泼尼松龙、甲泼

尼龙、地塞米松等。使用时需注意，使用指征为慢性损伤性炎症，而非细菌性炎症或肿瘤；严格无菌操作；注射部位准确无误；按规定剂量及方法使用；注射后一旦局部出现肿胀甚或红热者，应立即停止使用。(2) 合理使用非甾体抗炎药。该类药物对于解除或减轻局部的炎症、疼痛有明显效果，但均伴有不同程度的胃肠道反应，故不宜长期或大剂量服用。使用时需注意，应短期用药；病灶局限且浅表者使用涂搽剂；为减少胃肠道不良反应宜首选环氧酶2（COX-2）抑制药、前体药物及各种缓释剂、肠溶片、栓剂等；对肾功能欠佳者可选用短半衰期药物、对肾血流量影响较小的药物，如舒林酸及丙酸类；为减少对肝功能的影响可选用结构简单、不含氮的药物，避免使用吲哚美辛和阿司匹林；不宜将两种非甾体抗炎药联合使用，因其同时使用非但不增加疗效，反而不良反应倍增。

7.3.1.1 腰肌劳损及其药物治疗

腰肌劳损为腰部肌肉及其附着点的筋膜、韧带甚或骨膜的慢性损伤性炎症，为腰痛的常见原因。大多数下背部疼痛属自限性，可自行缓解。

药物治疗：①如果只有数个压痛点，可在肌筋膜疼痛触发点注射利多卡因，或合用糖皮质激素治疗。②腰部疼痛明显时，可服用非甾体抗炎药、镇痛药和局部皮肤贴剂。这些药物可独立或联合使用。③肌松药对某些急性下背部疼痛的患者有一定的帮助作用，作用机制尚未明晰。如美索巴莫 500 ~ 750 mg，每隔 6 小时口服。另外，苯二氮䓬类药（如地西泮）也可以短期使用。

7.3.1.2 滑囊炎和肌腱炎及其药物治疗

滑囊炎是关节附近出现的一种囊性肿物，病因尚不明确。肌腱炎是对肌腱任何炎症性疾病的统称。炎症可发生在肌腱内（如肱骨外上髁炎），或发生在肌腱滑膜鞘（如狭窄性腱鞘炎）。这两种疾病是导致机体软组织疼痛的最主要原因。

药物治疗：①非甾体类抗炎药用于治疗急性炎症。口服优布芬一次 600 mg，一日 3 次，或其他非甾体类抗炎药。症状严重者，口服吲哚美辛一次 25 mg，一日 4 次。持续应用时间不超过 5 ~ 7 日。②局部囊内或腱鞘内激素封闭。甲泼尼龙醋酸酯 20 ~ 40 mg。配以适量 1% 利多卡因注射液，可减轻注射所造成的局部疼痛。

7.3.1.3 肩关节周围炎及其药物治疗

肩关节周围炎简称肩周炎，是肩周、肌腱、肌、滑囊及关节囊的慢性损伤性炎症。肩周炎一般 1 年左右能自愈，但需配合治疗和功能锻炼，否则会遗留不同程度的功能障碍。

药物治疗：①痛点局限时，可局部注射甲泼尼龙醋酸酯。②持续疼痛，可短期服用优布芬一次 600 mg，一日 3 次，或其他非甾体类抗炎药，或加用氯唑沙宗 0.2 g，一日 3 次，以松弛痉挛的肌肉。

7.3.1.4 髌骨软骨软化症及其药物治疗

髌骨软骨软化症是髌骨软骨面的慢性损伤，软骨肿胀、侵蚀、龟裂、破碎、脱落，最后与之相对的股骨髁软骨也发生相同病理改变，而形成髌、股关节的骨关节病。

药物治疗：关节内注射醋酸泼尼松龙虽可缓解症状，但抑制糖蛋白、胶原合成，对软骨修复不利，故应慎用。非甾体抗炎药可起到控制急性疼痛的效果。

7.3.1.5 胫骨结节骨软骨病及其药物治疗

青少年胫骨结节处尚未骨化的骨骺受髌韧带作用，产生不同程度的撕裂。一旦骨骺融合，症状自行消失。急性期可服用优布芬，一次 600 mg，一日 3 次，或其他非甾体抗炎药。

7.3.1.6 周围神经卡压综合征及其药物治疗

周围神经在其行径中，经过某些骨纤维隧道或跨越腱膜、穿过筋膜处，其活动空间均受到明显限制。当这些隧道、腱膜、筋膜由于各种原因狭窄、增生、肥厚、粘连等均可使经过该处的神经被挤压，继而可使神经传导功能障碍。常见的有胸廓出口综合征（臂丛受压）、腕管综合征（正中神经受压）等。如痛点明确，可局部封闭治疗。注意不要将药物注入神经内，以

免加重症状。

7.3.2 骨病及其用药

骨病系指除创伤（急性或慢性）等外界因素作用外，骨骼系统自身发生病变的一系列疾病。结合受累部位和发病机制，一般分为颈、腰椎退行性疾病，骨、关节疾病，骨质疏松等。

7.3.2.1 颈椎退行性疾病及其药物治疗

颈椎退行性疾病包括颈椎病和颈椎管狭窄症。

颈椎病系指因颈椎间盘及其继发性改变，刺激或压迫相邻脊髓、神经、血管和食管等组织，并引起相应的症状和体征者。

药物治疗：可服用复方丹参片，一次 1 mg，一日 3 次和硫酸软骨素一次 1 g，一日 3 次等。

颈椎管狭窄症系指颈椎管容积减小，引致压迫颈髓而产生脊髓、神经症状。多见于中老年人，症状类似颈椎病。以手术减压为主要治疗。

7.3.2.2 腰椎退行性疾病及其药物治疗

腰椎退行性疾病包括腰椎间盘突出症、腰椎管狭窄、腰椎滑脱。

腰椎间盘突出症是腰腿痛常见原因，主要由于日常生活及劳动中的劳损造成了椎间盘的退行性病变。常见症状有腰痛和坐骨神经痛、下腹部痛或大腿前侧痛、麻木、间歇性跛行、马尾综合征、肌瘫痪等。

药物治疗：硬膜外注射糖皮质激素和少量麻醉药物可起到改善局部血运、减轻局部酸中毒、消炎止痛的作用。常用硬膜外腔注射药物为倍他米松磷酸二钠 10 mg、2% 利多卡因 4 ~ 6 ml、维生素 B_6 100 ~ 200 mg、维生素 B_{12} 500 ~ 1 000 μg，或用棕榈酸地塞米松 8 mg 替代倍他米松。一周注射 1 次，共 3 ~ 4 次。

腰椎管狭窄多由于腰椎退行性病变发生椎间盘膨出，黄韧带皱褶，椎体后缘骨赘形成，关节突关节增生、内聚等，使椎管容积缩小，导致椎管内压力增加，马尾缺血。该病多发于中老年及从事重体力劳动者。该病特点之一为症状重，体征轻。症状轻时可考虑卧床休息、减少活动、腰椎管硬膜外封闭等非手术治疗。

腰椎滑脱系指相邻两椎体发生向前或向后相对位移。临床以椎弓峡部裂性和退变性多见。程度较轻无明显症状者可考虑非手术治疗，程度较重者需手术治疗。

7.3.2.3 骨关节疾病及其药物治疗

常见的骨关节疾病包括非化脓性关节炎和感染性骨关节炎等。

7.3.2.3.1 非化脓性关节炎及其药物治疗

非化脓性关节炎系指感染性原因（化脓性、结核性等）之外的病因造成的关节及其周围软组织发生增生、肥大、活动范围减小、功能减低、疼痛等症状的多种疾病，包括原发于关节的疾病和其他疾病继发的关节表现。常见的有骨关节炎、强直性脊柱炎、类风湿关节炎、痛风性关节炎、血友病性关节炎等。具体用药原则请参见常见的风湿病及其药物治疗，痛风及其药物治疗。

7.3.2.3.2 感染性骨关节炎及其药物治疗

感染性骨、关节炎是指任何微生物对骨骼、关节滑膜的侵蚀，其中以化脓性细菌感染引起的骨关节炎最为常见。此外尚有骨与关节结核（肺外继发性结核）。

一般细菌感染的药物治疗：根据细菌革兰染色结果制订初始用药方案，关节腔内灌洗抗生素可引起化学性滑膜炎，不建议采用；采用非肠道途径迅速给药，确保血液药物浓度达到一定值。根据细菌培养结果选择抗生素种类。抗生素持续时间取决于病原体种类，对治疗的反应及关节周围组织条件。一般淋球菌性关节炎使用抗生素连续 7 日，而其他细菌感染则大多需使用抗生素 2 ~ 4 周。

骨与关节结核的药物的治疗：采用结核病的标准化治疗。抗结核药物治疗应贯穿治疗整个过程，并在综合治疗中占主导地位，口服异烟肼一日 300 mg 和利福平一次 300 mg，一日 2 次，连续 12 个月。初始 2 个月内需加用吡嗪酰胺一日 25 mg/kg，最多可达到一日 2.5 g。

7.3.2.4 骨质疏松及其药物治疗

骨质疏松（osteoporosis）是一种代

谢性疾病，表现为骨密度降低，骨间质微结构破坏，矿物质减少。发病多缓慢，以骨骼疼痛、易于骨折为特征。生化检查基本正常。90%老年骨折患者与骨质疏松症有关。

药物治疗：①补充钙和维生素 D_3。有关卫生部门建议绝经后妇女每日摄入 1 000 ~ 1 500 mg 元素钙，400 ~ 800 U 维生素 D_3。碳酸钙的吸收需要有相当的酸性环境。枸橼酸钙最易被吸收，也可防止肾脏结石。②治疗药物，老人骨折有很高的致残和致死率，所以只要符合骨质疏松诊断标准，应接受药物治疗。常用药物有 5 类。双膦酸盐类是治疗骨质疏松的一线药物，如阿仑磷酸钠，利塞膦酸钠等。它能提高骨密度，同时降低椎体和股骨颈骨折的发生。双磷酸盐类抑制破骨细胞的功能，减少骨吸收，因此对高转换率的骨质疏松特别适用。有一定的胃肠道不良反应。甲状旁腺激素，能促进新骨形成，对骨转换低下的骨质疏松特别有效，也能促进骨折愈合。不良作用有抽筋和直立性低血压。用于绝经前骨转换低下妇女，或者对双磷酸盐没有反应，或在双磷酸盐治疗同时出现的骨折患者。降钙素对预防椎体骨折起一定作用，但对椎体以外部位骨折没有预防作用。有一定的止痛作用，所以常被用于骨痛和骨折患者。不良反应轻微，包括鼻出血。雌激素，治疗效果存在争议。虽然有证据表明雌激素对骨质有好处，但可能引起各种不良反应包括静脉血栓、卒中、乳癌等。雌激素替代疗法可用于有绝经期症状的患者，不能作为一线用药，只短期使用选择型雌激素受体调节药。可增加骨量，减少椎体骨折。对椎体外骨折没有预防作用。对乳癌可能有防护作用，但能加重绝经后症状和静脉炎。

7.3.3 中枢性骨骼肌松弛药及其他药物

氯唑沙宗

Chlorzoxazone

【适应证】用于各种急、慢性软组织扭伤，中枢神经病变引起得肌肉痉挛，慢性筋膜炎等。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女，有肝病史及肝肾功能损害者慎用。(2) 应用本品时饮酒，能增强本品药效，剂量应酌减。(3) 服用本剂期间应避免进行注意力需高度集中得活动，如驾驶、登高、操作精密仪器等。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、腹泻、便秘等消化道症状为主；偶见嗜睡、眩晕、轻度头痛；极少见胃肠出血症、肝功能损害、皮疹、血管神经水肿等。

【用法与用量】口服：①成人一次 0.2 ~ 0.4 g，一日 3 次，症状严重者酌加。②儿童一日 20 mg/kg，分 3 ~ 4 次服用。③复方氯唑沙宗片，一次 2 片，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】氯唑沙宗片：0.2 g。

复方氯唑沙宗片：每片含氯唑沙宗 125 mg、对乙酰氨基酚 150 mg，两者对镇痛有协同作用。

乙哌立松[保(乙)]

Eperisone

【适应证】(1) 改善下列疾病的肌紧张状态，如颈肩臂综合征、肩周炎、腰痛症。(2) 改善下列疾病引起的痉挛性麻痹，如脑血管障碍、痉挛性脊髓麻痹、颈椎症、手术后遗症（包括脑、脊髓肿瘤）、外伤后遗症（脊髓损伤、头部外伤）、肌萎缩性侧索硬化症、小儿脑性瘫痪，小脑变性症、脊髓血管障碍、亚急性视神经脊髓病 (SMON) 及其他脑脊髓疾病。

【注意事项】(1) 下列患者慎用，如肝肾功能不全者、孕妇及哺乳期妇女、儿童。(2) 服用本品时，有时会出现四肢无力、站立不稳、困倦等症状。当出现这些症状时，应减少用量或停止用药。(3) 用药期间不宜从事驾驶车辆等有危险性的机械操作。(4) 一般情况下老年人应减量。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 严重的不良反应：有可能发生休克现象，故应注意观察，当出现异常症状时，应停止用药，并采取适当措施。(2) 其他不良反应：AST 及 ALT、ALP 等的上升，尿蛋白、BUN 上升，贫血、皮疹、瘙痒、困倦、失眠、头痛、四肢麻木、身体僵硬、四肢发颤、呕

吐、食欲减退、胃部不适、腹痛、腹泻、便秘、口渴、口腔炎、腹胀感、尿潴留、尿失禁、残尿感、无力感、站立不稳、全身怠倦感、肌紧张减退、头晕、热感、出汗、水肿等。当出现异常症状时应停药并采取适当措施。

【用法与用量】口服：成人一次1片50 mg，一日3次，餐后服用。剂量可视年龄、症状酌情增减，或遵医嘱。

【制剂与规格】盐酸乙哌立松片：50 mg。

替扎尼定[保(乙)]

Tizanidine

【适应证】本品为中枢性骨骼肌松弛药，用于：①颈、肩及腰部疼痛等局部疼痛综合征等疾病造成的骨骼肌紧张状态的改善；②脑血管障碍、痉挛性脊髓麻痹、颈椎病、小儿麻痹症、手术后遗症（脊髓损伤、大脑损伤）、脊 小脑变性症、多发性硬化症、肌萎缩性侧索硬化症等引起中枢性肌痉挛。

【注意事项】(1) 服药初期可能伴有血压急剧下降，当合用抗高血压药时更要警惕，不应与其他的 α_2 受体激动药合用。(2)肝功能不全者慎用。在肾功能不全(肌酐清除率＜25ml/min）或肝功能严重损害的患者中，推荐的初始剂量为2 mg，一日1次。若需加大剂量，则应根据患者的耐受性和疗效缓慢的进行。(3) 在治疗早期，须告诫发生嗜睡的患者，应避免作需要高度警觉的活动，如驾驶或操作机械。(4)妊娠及哺乳期妇女应充分权衡利弊后，方可考虑应用。儿童用药的安全性尚未充分评价。(5) 对老年患者，本品可使血药浓度持续升高，故注意减少剂量，本品有降压作用，老年患者用药应慎重。

【禁忌证】对本品过敏的患者禁用。

【不良反应】应用所推荐的低剂量盐酸替扎尼定片来解除疼痛性肌痉挛时，不良反应极少，且通常为轻微而短暂的，它们包括嗜睡、疲乏、头晕、口干、恶心、胃肠道功能紊乱及血压轻度降低。应用所推荐的高剂量盐酸替扎尼定片治疗中枢性肌痉挛时，上述不良反应较常见且明显，不过严重到需要终止治疗者极少。导致终止治疗的最常见的不良事件有疲乏（3%），嗜睡（3%）、口干（3%）、痉挛程度或张力增加（2%）和头晕（2%）。其中，乏力、嗜睡／镇静、口干和头晕为最常发生的不良事件，这些不良事件有剂量依赖性。另外，还可能产生低血压、脉搏缓慢、 肌无力、失眠、睡眠障碍、幻觉、肝炎等不良反应。

【用法与用量】口服：(1) 用于疼痛性肌痉挛：一次2 mg，一日3次，并根据年龄、症状酌情增减。(2) 用于中枢性肌痉挛：应根据患者需要而做剂量调整。初始剂量不应超过一日6 mg（分3次服用），并可每隔半周或1周渐增2～4 mg。通常一日12～24 mg（分3～4次服用）的用量已可获得良好的疗效，一日总量不能超过36 mg。

【制剂与规格】盐酸替扎尼定片：4 mg。

巴氯芬[保(乙)]

Baclofen

【适应证】用于缓解由以下疾病引起的骨骼肌痉挛：①多发性硬化、脊髓空洞症、脊髓肿瘤、横贯性脊髓炎、脊髓外伤和运动神经元病；②脑血管病、脑性瘫痪、脑膜炎、颅脑外伤。

【注意事项】(1) 本品可透过胎盘屏障，妊娠期用药的安全性尚未被证实，用药请权衡利弊。哺乳期妇女应慎用本品。(2) 肝肾功能不全、有癫痫病史或惊厥发作、溃疡病、脑卒中，伴有精神障碍、精神分裂症或意识错乱的患者慎用。(3) 12岁以下儿童不宜使用。(4) 老年人应低剂量用药。(5) 应逐渐减量，否则易出现幻觉和癫痫发作。(6) 服药期间避免驾车和操作机器。(7)卒中患者对本品耐受性差。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者。(2) 癫痫、帕金森病、风湿性疾病引起的骨骼肌痉挛患者。(3) 妊娠初期3个月内禁用。

【不良反应】主要是见于治疗开始时、剂量增加过快、剂量过大的患者，一般为轻微的暂时性症状。精神病史患者、伴脑血管病患者和老年患者不良反应可能较为严重。(1) 中枢神经系统：治疗开始时常出现日间镇静、嗜睡和恶心等不良反

应，偶尔出现口干、呼吸抑制、头晕、无力、精神错乱、眩晕、呕吐、头痛和失眠。(2) 神经精神病学的表现偶有或罕见报道有：欣快感、抑郁、感觉异常、肌痛、肌无力、共济失调、震颤、眼球震颤、调节紊乱、幻觉、噩梦。上述症状常难以与疾病本身的表现相区别。可能会降低惊厥阈，并引起惊厥发作，癫痫患者尤应注意。(3) 消化系统：偶有轻度的胃肠功能紊乱、便秘、腹泻、腹痛、恶心、食欲减退、味觉失常、粪隐血试验阳性等。(4) 心血管系统：偶见低血压、心功能不全。(5) 泌尿生殖系统：偶见或罕见排尿困难、尿频、遗尿，这些常难于与疾病本身的表现相区别。其他尚有阳痿、射精不佳等。(6) 其他：罕见或个别病例有视力障碍、膝关节肿胀、多汗、体重增加、皮疹、肝肾及骨髓功能损害。某些病人对药物可显反常的反应而表现为痉挛状态加重。可能会出现肌张力过低，使病人更难于行走或照料自己，这种情况通常在调节剂量后可缓解(如：减少日间剂量，可能的话增加夜间剂量)。

【用法与用量】口服：①成人初始剂量为一次 5 mg，一日 3 次，应逐渐增加剂量，每隔 3 日增加 5 mg，直至所需剂量，但应根据病人的反应具体调整剂量。对本品作用敏感的患者初始剂量应为一日 5 ~ 10 mg，分 1 ~ 2 次服，剂量递增应缓慢。常用剂量为一日 30 ~ 75 mg，分 3 次服。最大剂量为 80 mg，分 3 ~ 4 次服。停药前应逐渐减量。②儿童初始剂量按体重一日 0.3 mg/kg，维持量按体重一日 0.75 ~ 2 mg/kg。对 10 岁以上儿童一日最大剂量可达 2.5 mg/kg。通常治疗开始时一次 2.5 mg，一日 4 次。约每隔 3 日小心增加剂量，直至达到儿童个体需要量。推荐的一日维持治疗量为 12 个月 ~ 2 岁儿童，10 ~ 20 mg；2 ~ 6 岁儿童，20 ~ 30 mg；6 ~ 10 岁儿童，30 ~ 60 mg（最大量 70 mg）。

【制剂与规格】巴氯芬片：① 10 mg；② 25 mg。

辣椒碱软膏[保(乙)]

【适应证】用于骨关节炎、其他慢性急性发作的关节炎或软组织损伤性疼痛病变的局部治疗。

【注意事项】为外用止痛膏。避免用于皮肤损伤或开放性创面。勿接触眼和黏膜。

【禁忌证】对本品及其成分过敏者，有开放伤口者。

【不良反应】偶可发生皮疹、皮肤瘙痒、发红和刺痛。

【用法与用量】外用：取适量均匀涂抹于关节疼痛部位，并进行搓揉数分钟以保证药物透入皮内，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】辣椒碱软膏：10 g。

甲钴胺 用于周围神经病，因缺乏维生素 B_{12} 引起的巨幼细胞贫血。口服：成人一次 500 μg，一日 3 次。肌内或静脉注射，一次 500 μg，一日 1 次，一周 3 次。肌内或静脉注射的剂量，可按年龄、症状酌情增减。用药 2 个月后，维持量为 1 ~ 3 个月给药 500 μg。(其他见 7.10)

第8章 泌尿系统疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 肾病综合征
- IgA 肾病
- 狼疮性肾炎
- 抗中性粒细胞胞浆抗体相关性小血管炎肾损害
- 间质性肾炎
- 急性肾衰竭
- 慢性肾衰竭
- 肾移植
- 泌尿和男性生殖系统感染

- 膀胱过度活动症
- 前列腺增生
- 前列腺炎
- 勃起功能障碍
- 阴茎异常勃起
- 泌尿和男性生殖系统肿瘤

本章涉及的疾病包括3个方面：泌尿内科疾病、泌尿外科疾病、男性生殖系统疾病，其药物治疗也包括这3个方面。

常见的需要药物治疗的泌尿及男性生殖系统疾病，包括原发性和继发性的肾小球疾病、肾小管间质疾病、肾血管疾病、系统性疾病的肾损害，尿路及男性生殖系统的普通细菌感染，病毒、支原体、衣原体、螺旋体、结核菌等特殊致病微生物的感染，肿瘤，以及肾脏、膀胱、男性器官的功能障碍等。

虽然药物在泌尿系统疾病的治疗非常重要，如降压药、糖皮质激素、免疫抑制药、抗生素、利尿药、抗血小板聚集药等，但由于不是泌尿系统疾病特有的，在相关章节已有详细的介绍，本章只对其适应证、用法用量作扼要的介绍，不良反应、与其他药物的相互作用、禁忌证、注意事项、剂型等，请参考有关章节。本章还详细介绍男性生殖系统疾病的用药。

8.1 肾病综合征及其药物治疗

8.1.1 肾病综合征

肾病综合征（nephrotic syndrome, NS）是常见的临床综合征，其诊断标准是：①大量蛋白尿（每24小时超过3.5 g）；②血浆白蛋白＜30 g/L；③水肿；④高脂血症。前两条为诊断的必备条件。NS分为原发性和继发性两大类。本文的药物治疗主要针对原发性NS。

8.1.2 药物治疗

8.1.2.1 对症治疗

（1）低盐饮食：水肿时应低盐（每日＜3 g）。

（2）利尿消肿：①噻嗪类利尿药：适用于轻度水肿病人，常用氢氯噻嗪一次25 mg，一日3次，长期服用应防止低钾、低钠血症。②潴钾利尿药：适用于低钾血症，常用螺内酯一次20 mg，一日1～2次；或氨苯蝶啶一次50 mg，一日1～2次。单独使用利尿作用不显著，可与噻嗪类利尿药合用。长期使用需防止高钾血症，对肾功能不全病人应慎用。③襻利尿药：适用于中、重度水肿病人，常用呋塞米一日20～120 mg，或布美他尼一日1～5 mg，分次口服或静脉注射。应用襻利尿药时需谨防低钠血症及低钾、低氯血症性碱中毒。④右旋糖酐或羟乙基淀粉：常用不含钠的右旋糖酐-40（低分子右旋糖酐）或羟乙基淀粉（分子量2.5万～4.5万），一次250～500 ml静脉滴注，隔日1次。随后加襻利尿药可增强利尿效果。但对少尿（一日尿量＜400 ml）病人应慎用或避免使用。NS病人利尿要避免过度和过猛，以免造成血容量不足，加重血液高黏倾向，诱发血栓、栓塞并发症。

（3）减少尿蛋白：ACEI或ARB有不依赖于降低全身血压的减少尿蛋白作用，应用其降尿蛋白时，剂量一般应比常规降压剂量大（应监测血压），才能获得良好疗效。血容量严重不足或应用强利尿药后应慎用，以免诱发急性肾功能不全。

8.1.2.2 抗炎及免疫抑制治疗

（1）糖皮质激素：激素可以通过抑制炎症反应、抑制免疫反应、抑制醛固酮和抗利尿激素分泌、影响肾小球基底膜通透性等综合作用而发挥其利尿、消除尿蛋白的疗效。使用原则和方案一般是：①起始足量。常用药物为泼尼松一日1 mg/kg，口服8周，必要时可延长至12周；局灶节段性肾小球硬化病人应延长至3～4个月。②缓慢减量。足量治疗后每2～4周减原用量的10%，当减至一日20 mg左右时症状易反复，应更加缓慢减量。③长期维持。最后以最小有效剂量（一日10 mg左右）再维持半年左右。可采取全日量顿服或在维持用药期间两日量隔日1次顿服，以减轻激素的不良反应。水肿严重、有肝功能损害或泼尼松疗效不佳时，可更换为泼尼松龙（等剂量）或甲泼尼龙（4 mg甲泼尼龙相当于5 mg泼尼松）口

服或静脉滴注。地塞米松半衰期长，不良反应大，现已少用。

根据患者对糖皮质激素的治疗反应，可将其分为“激素敏感型”（用药 8 ~ 12 周 NS 缓解）、“激素依赖型”（激素减量到一定程度即复发）和“激素抵抗型”（激素治疗无效）3 类，其各自的进一步治疗有所区别。

长期应用激素的患者可出现感染、药物性糖尿病、骨质疏松等不良反应，少数病例还可能发生股骨头无菌性缺血性坏死，需加强监测，及时处理。

(2) 免疫抑制药：这类药物可用于“激素依赖型”或“激素抵抗型”的患者，协同激素治疗。若无激素禁忌，一般不作为首选或单独治疗用药。

①环磷酰胺：是国内外最常用的细胞毒药物，在体内被肝细胞微粒体羟化，产生有烷化作用的代谢产物而具有较强的免疫抑制作用。应用剂量为一日 2 mg/kg，分 1 ~ 2 次口服；或一次 200 mg，隔日静脉注射 1 次。累积量达 8 ~ 10 g 后停药。主要不良反应为骨髓抑制及中毒性肝损害，并可出现性腺抑制（尤其男性）、脱发、胃肠道反应及出血性膀胱炎。

②环孢素：选择抑制辅助性 T 细胞及细胞毒效应 T 细胞，已作为二线药物用于治疗激素及细胞毒药物无效的难治性 NS。常用量为一日 3 ~ 5 mg/kg，分 2 次空腹口服，服药期间需监测并维持其血药浓度谷值为 100 ~ 200 ng/ml。服药 2 ~ 3 个月后缓慢减量，疗程半年至 1 年。不良反应有肝肾毒性、高血压、高尿酸血症、多毛及牙龈增生等。停药后易复发是该药的不足之处。

③吗替麦考酚酯（Mycophenolate Mofetil，MMF）：在体内代谢为霉酚酸，后者为次黄嘌呤单核苷酸脱氢酶抑制药，抑制鸟嘌呤核苷酸的经典合成途径，故而选择性抑制 T、B 淋巴细胞增殖及抗体形成达到治疗目的。常用量为一日 1.5 ~ 2 g，分 2 次口服，共用 3 ~ 6 个月，减量维持半年。近年一些报道表明，该药对部分难治性 NS 有效，相对不良反应较少。尽管尚缺乏大宗病例的前瞻性对照试验的研究结果，但已受到重视。因其价格较高，目前仍作为二线用药。已有偶见严重贫血和个别（多见于肾功能损伤者）应用后导致严重感染的报道，应引起足够重视。

④他克莫司（Tacrolimus）又称 FK506，为具有大环内酯结构的免疫抑制药物。该药物和体内 FK506 结合蛋白（FKBPs）相结合形成复合物，抑制钙调素，从而抑制 T 细胞钙离子依赖型信息传导，抑制细胞毒性淋巴细胞的生成。该药物作为强抗排异药物，用于肝、肾等器官移植患者。国内已试用于难治性 NS，常用诱导剂量为一日 4 ~ 6 mg，分 2 次空腹服用，持续半年；常用维持剂量为一日 2 ~ 4 mg，分 2 次空腹服用，维持时间为半年。血液浓度应维持在 5 ~ 10 ng/ml。至今无大规模病例治疗 NS 的循证医学结果，但初步的治疗结果已显示良好的降尿蛋白疗效。尽管其不良反应相对较轻，但可引起感染、消化道症状（如腹泻、恶心、呕吐）、肝功损害、高血糖和神经毒性（如头痛、失眠、震颤）等不良反应，予以重视。

⑤雷公藤多苷，一次 10 ~ 20 mg，一日 3 次口服，有降尿蛋白作用，可配合激素应用。国内研究显示该药具有抑制免疫、抑制肾小球系膜细胞增生的作用，并能改善肾小球滤过膜通透性。主要不良反应为性腺抑制、肝功能损害及外周血白细胞减少等，及时停药后可恢复。本药不良反应较大，甚至可引起急性肾衰竭，用时要小心监护。

⑥其他：也有关于应用苯丁酸氮芥、硫唑嘌呤、来氟米特等免疫抑制药。

糖皮质激素和免疫抑制药的应用要严格掌握适应证和禁忌证，减少不良反应和用尽量小的剂量达到尽可能大的疗效。糖皮质激素应用方式、剂量及时间和免疫抑制药的选择应根据患者 NS 的病因、肾活检病理类型、临床特点（如肾功能、尿蛋白等）、年龄等主要因素掌握。

8.1.2.3 并发症的防治

原发性 NS 容易合并静脉血栓或栓塞等并发症，要注意防治，以提高疗效，降低病死率。对于血纤维蛋白原和 D-二聚体增高的患者，可用抗血小板聚集药，双嘧达莫一次 50 ~ 100 mg，一日 3 次；或

氯吡格雷，一次75 mg，一日1次；高凝状态明显者，可考虑用低分子肝素一次4 000～5 000 U，一日1次，皮下注射（注意避免肌内注射）。

8.2 IgA肾病及其药物治疗

8.2.1 IgA肾病

IgA肾病（IgA nephropathy）是以肾小球系膜区IgA沉积为特征的肾小球肾炎，其主要临床表现为不同程度的血尿，可有蛋白尿、高血压及慢性进行性肾功能减退。IgA肾病分为原发性和继发性，确诊需要肾活检病理诊断。本文的治疗主要是针对原发性IgA肾病。

8.2.2 药物治疗

治疗的选择主要根据不同的临床表现和病理改变。

（1）扁桃体反复感染或其炎症状态与反复发作性肉眼血尿、镜下血尿、蛋白尿密切相关的患者，应尽早行扁桃体摘除。

（2）血压和肾功能正常、尿蛋白阴性的单纯镜下血尿的患者，不需要特殊治疗，但要定期复查。

（3）血尿伴有轻、中度蛋白尿每日＜2 g的患者，可用ACEI或ARB以及抗血小板聚集药治疗，常用的有双嘧达莫一次50～100 mg，一日3次，氯吡格雷一次75 mg，一日1次。如果使用足量的ACEI或ARB，血压已降至125/75 mmHg以下，尿蛋白仍每24小时＞1 g，可加用糖皮质激素治疗，泼尼松一日0.8～1 mg/kg（一日最大量不宜超过60 mg），连续8周，此后逐渐减量，2～4周减5 mg，一日20 mg以内1～3个月减5 mg。

（4）尿蛋白每日＞2 g、轻度肾功能不全、病理显示细胞增殖或炎细胞浸润等活动性病变为主的患者，可在上述治疗基础上，加用糖皮质激素或免疫抑制药，以减少尿蛋白、延缓肾功能减退。临床常用的免疫抑制药有吗替麦考酚酯一次0.75 g，一日2次、咪唑立宾（见第10章 肿瘤用药）一次100 mg，一日2次，半年至一年后可减量。使用咪唑立宾时要注意高尿酸血症的不良反应。病理表现球囊粘连、明显纤维蛋白沉积的患者，可试用尿激酶促纤维蛋白溶解治疗，一次10万U，溶于5%葡萄糖注射液250 ml静脉滴注，一日1次，10日为1个疗程；隔20日可再用。肾活检1个月内，或有出血倾向的患者慎用或禁用尿激酶。

（5）大量蛋白尿或肾病综合征病理改变轻微者（如光镜检查表现为轻微病变、轻度系膜增生性肾炎），糖皮质激素和免疫抑制药常可获得较好疗效。伴有高凝血症的患者，可加用低分子肝素，一次4 000～5 000 U，一日1次，皮下注射（特别注意避免肌内注射）。

（6）合并高血压的患者，除外肾动脉狭窄后，首选ACEI或ARB，目标血压为125/75 mmHg。合并高尿酸血症的患者，首选氯沙坦钾口服，一次50～100 mg，一日1次。血压控制不达标时，可加用长效钙通道阻滞药等其他类降压药。

（7）肾功能急剧恶化的病人，宜首先明确肾功能不全的原因。如合并恶性高血压，应积极控制血压。如病理表现为新月体性肾炎或毛细血管襻坏死应给予甲泼尼龙冲击治疗，一次500～1 000 mg，一日1次，静脉滴注，3日为1个疗程。必要时2周后可重复一次，随后给予常规剂量的糖皮质激素和免疫抑制药治疗。

（8）肾脏已缩小、多数肾小球球性硬化、肾间质弥漫性纤维化的肾衰竭患者，不宜再用糖皮质激素和免疫抑制药治疗，则宜给予慢性肾衰竭一体化治疗。肾功能不全的患者使用ACEI或ARB治疗时，需谨慎、并动态观察肾功能变化，注意高血钾的不良反应。

8.3 狼疮性肾炎及其药物治疗

8.3.1 狼疮性肾炎

狼疮性肾炎（lupus nephritis，LN）是系统性红斑狼疮（systemic lupus erythematosus，SLE）最常见的器官损害之一，主要表现为蛋白尿、血尿，可出现不同程度的肾功能不全。SLE的诊断是LN诊断的前提，少数患者以LN为SLE的首发表现。目前LN尚无统一的治疗方案，应根据临床表现、病理特征及疾病活动程度

制定个体化治疗方案。

8.3.2 药物治疗

（1）轻度肾脏损害：尿蛋白轻微、尿沉渣无活动性变化、血压和肾功能正常、病理表现轻微者一般无需特殊处理，或仅给对症治疗，但要注意控制肾外狼疮活动和密切注意肾脏损害的变化。

（2）局灶增生性 LN：无临床和严重组织学病变活动者，可对症治疗或小剂量糖皮质激素（泼尼松一日 0.5 mg/kg）和（或）环磷酰胺。如有弥漫性节段性肾损害、大量蛋白尿、活动性尿沉渣（主要指明显血尿）和血肌酐升高者，治疗同弥漫增生性 LN。

（3）弥漫增生性和严重局灶增生性 LN：对处于急性期，病情明显活动的患者，先给予足量糖皮质激素（泼尼松一日 1 mg/kg）联合免疫抑制药诱导治疗（见本章肾病综合征用药），待疾病活动得到控制后转人维持治疗。活动性弥漫性 LN 伴近期内肾功能显著恶化者，可用甲泼尼龙冲击治疗，一次 500 ~ 1 000 mg，一日 1 次，静脉滴注，3 日为 1 个疗程，必要时 2 周后可重复一次。冲击后常规糖皮质激素治疗，泼尼松一日 0.8 ~ 1 mg/kg（一日最大量不宜超过 60 mg），连续 8 周，此后逐渐减量，直至一日 7.5 mg 左右维持。常联合应用环磷酰胺，常规口服一次 50 mg，一日 2 次，总量控制在 8 ~ 10 g。近年来国内外不少专家推荐应用环磷酰胺冲击治疗代替常规口服：一次 0.75 ~ 1.0 g/m²（如每分钟 Ccr<30 ml，则 0.5 g/m²），溶于氯化钠注射液 250 ml 静脉滴注，1 个月 1 次；一般冲击 6 次；其后改为每 2 ~ 3 个月 1 次，总疗程共 1.5 ~ 2 年。研究显示环磷酰胺冲击治疗的患者白细胞减少、严重感染和性腺受损的发生率显著低于常规口服的患者，同一时间内环磷酰胺累积量仅为常规口服组的 1/3 ~ 1/2。

（4）膜性 LN：表现为无症状蛋白尿和肾功能稳定者可给予对症治疗，控制肾外活动；肾病综合征者则需使用足量糖皮质激素（泼尼松一日 1 mg/kg）联合免疫抑制药治疗。

（5）膜性 LN 合并增生性 LN：可用激素联合两种不同作用机制的免疫抑制药（如吗替麦考酚酯和他克莫司），但每种药物的剂量可减少至常规剂量的 1/2 或 2/3。

对大剂量激素及环磷酰胺治疗无效或不能耐受者，可用环孢素（一日 3 ~ 5 mg/kg），常与中小剂量泼尼松联合应用。近年也有吗替麦考酚酯（一次 0.75 g，一日 2 次）或来氟米特（一次 20 ~ 30 mg，一日 1 次）与糖皮质激素联合有效治疗 LN 的报道。硫唑嘌呤（一日 100 mg）适用于轻、中度的 LN 病人，也可用于维持治疗的患者。

8.4 抗中性粒细胞胞浆抗体相关性小血管炎肾损害及其药物治疗

8.4.1 抗中性粒细胞胞浆抗体相关性小血管炎肾损害

韦格纳肉芽肿（Wegener granulom - atosis，WG）、显微镜下型多血管炎（micr - oscopic polyangiitis，MPA）、变应性肉芽肿（Churg-strauss syndrome，CSS）和少免疫沉积型坏死性新月体性肾炎（necrotic crescentic glomerulonephri - tis，NCGS）的发病机制与抗中性粒细胞胞浆抗体（antineutrophil cytoplasmic antibody，ANCA）相关，目前统称为 ANCA 相关性小血管炎（ANCA-associated small vasculitis，AASV）。AASV 可累及肾外多个系统，肾脏也往往是最为严重、甚至是唯一的受累器官。

AASV 的治疗可分为诱导缓解治疗、维持缓解治疗和复发治疗。

8.4.2 药物治疗

8.4.2.1 抗炎及免疫抑制治疗

（1）糖皮质激素：诱导缓解治疗泼尼松口服初期治疗量为一日 1 mg/kg，顿服或分次服，一般是用 4 ~ 8 周后，改为 1 mg/kg 隔日顿服，维持 2 个月，其后每 1 ~ 2 周减量 5 mg，直至全部撤完。整个疗程不应少于 6 个月。对于有重要脏器损害的重症病人提倡用甲泼尼龙静脉冲击，一次 0.5 ~ 1.0 g，一日 1 次，连续 3 日；

其后口服泼尼松同前述口服治疗方案。

(2) 免疫抑制药

①环磷酰胺 (CTX)：一般用泼尼松后1～2周开始应用，一日 CTX 2mg/kg，口服，持续约3个月。其后可用硫唑嘌呤维持缓解。或者采用 CTX 静脉冲击治疗，常用的方法是 CTX 诱导剂量为一次 $0.75 \sim 1.0\,g/m^2$（如每分钟 Ccr<30ml，则 $0.5\,g/m^2$），1个月1次，连续6个月，其后维持治疗为2～3个月1次，剂量同前。整个疗程为1.5～2年。

②硫唑嘌呤 (AZA)：在维持缓解治疗阶段，AZA 是被证实能有效替代 CTX 的药物。口服3个月 CTX 后用硫唑嘌呤（一日 2mg/kg），维持时间1.5～2年，甚至更长时间以减少复发。

③其他免疫抑制药：吗替考酚酯（一次0.75g，一日2次)、来氟米特（一次20～30mg，一日1次)、环孢素（一日3～5mg/kg）已有部分成功诱导和（或）维持缓解治疗的报道，但尚缺乏循证医学研究报道。

8.4.2.2 血浆置换疗法

主要适应证为有威胁生命的肺出血、合并有抗 GBM 抗体阳性或表现为急性肾衰竭需要血液透析的患者。

8.4.2.3 抗感染治疗

应用复方磺胺甲噁唑（一次2片，一日2次）清除金黄色葡萄球菌可显著减少 WG 的复发。在应用糖皮质激素与免疫抑制药治疗的过程中，也有学者建议应用磺胺类药物预防卡氏肺囊虫的感染。

最近有报道，鼻腔局部应用莫匹罗星也可以较好地清除金黄色葡萄球菌，还可以用于肾脏受损和无法应用复方磺胺甲噁唑的 WG 病人。

8.5 间质性肾炎及其药物治疗

8.5.1 间质性肾炎

间质性肾炎可分为急性间质性肾炎 (acute interstitial nephritis, AIN) 和慢性间质性肾炎 (chronic interstitial nephritis, CIN)，前者主要表现为肾间质炎症细胞浸润及肾小管退行性变等急性病变，后者主要表现为肾间质纤维化及肾小管萎缩等慢性病变。

8.5.2 药物治疗

(1) 药物过敏性 AIN，应首先停用致敏药物，多数轻症病例可自行缓解；重症病例宜服用小剂量糖皮质激素（如泼尼松，一日30～40mg，病情好转后逐渐减量，疗程约2个月）；急性肾衰竭病例应进行透析治疗，协助病人渡过难关。

(2) 药物性 CIN（如马兜铃酸肾病)，若为早期 CIN 应积极去除致病因子，以延缓肾损害进展；如 CIN 后期表现为肾小管酸中毒、肾性贫血及高血压，应予以相应治疗。进入终末期肾衰竭的 CIN 病人则应给予透析或肾移植治疗。

8.6 急性肾衰竭及其药物治疗

8.6.1 急性肾衰竭

急性肾衰竭 (acute renal failure, ARF) 是指以肾小球滤过率在短期内（数小时至数周）急剧下降、代谢产物潴留、水电解质及酸碱平衡紊乱为特征的临床综合征。根据病因不同分为肾前性，肾性和肾后性 ARF。狭义的 ARF 是指急性肾小管坏死 (acute tubular necrosis, ATN)，临床上最常见的原因是肾缺血和（或）肾毒性损伤。根据尿量的多少，ARF 分为少尿型（每日少于400ml）和非少尿型（每日>400ml)。典型的 ATN 病程演变一般经过3个阶段，即少尿期、多尿期和恢复期。根据分解代谢的不同，ARF 又分为高分解代谢型和非高分解代谢型，前者一日血尿素氮上升 >8.9mmol/L、血肌酐上升 >177μmol/L。

8.6.2 药物治疗

ARF 的治疗原则，一般包括去除可逆的病因，纠正水与电解质代谢紊乱，防治并发症，必要时及时进行血液净化治疗。

(1)少尿期治疗：控制液体入量，以“量出为入”为原则（可按前日尿量加500ml计算)；注意代谢性酸中毒及高钾血症的监测与处理，前者可以口服或静脉滴注

碳酸氢钠，后者多采取普通胰岛素与葡萄糖溶液静脉滴注，和（或）10%葡萄糖酸钙10 ml静脉注射，和（或）钙型或钠型降钾离子交换树脂（如聚磺苯乙烯钠一次15～30 g，一日1～2次）口服或保留灌肠等。

ARF开始血液净化治疗的指征为：①利尿药（如呋塞米一日20～400 mg）难以控制的容量负荷过重（肺水肿、脑水肿和高血压等）；②药物治疗难以控制的高钾血症（血清钾＞6.5 mmol/L）；③肾功能严重受损，血肌酐水平迅速升高（48小时升高至基线值的300%以上）。血液净化治疗，包括血液透析、腹膜透析和连续性血液净化等。对于高分解代谢型的ARF患者，应尽早进行血液净化治疗。

蛋白质摄入量宜控制至一日0.6～0.8 g/kg，并补充足够的热量一日30～35 kcal/kg。已进行血液净化治疗的患者则应适当增加蛋白质的摄入量。

（2）多尿期治疗：重点是维持水、电解质和酸碱平衡，控制氮质血症和防止各种并发症。

（3）恢复期：无需特殊治疗，需随访肾功能。

8.7 慢性肾衰竭及其药物治疗

8.7.1 慢性肾衰竭

慢性肾衰竭（chronic renal failure，CRF）是指慢性肾脏疾病（chronic kidney disease，CKD）患者肾小球滤过率下降，导致体内代谢产物蓄积，水、电解质和酸碱平衡紊乱及全身各脏器损害的综合征。CRF分为四期：肾功能代偿期（Ccr每分钟50～80 ml）、肾功能失代偿期（Ccr每分钟20～50 ml）、肾衰竭期（Ccr每分钟10～20 ml）和尿毒症期（Ccr每分钟少于10 ml）。

8.7.2 药物治疗

CRF的治疗主要是防治并发症，强调一体化治疗。

（1）营养治疗：通常从肾功能失代偿期开始给予患者优质低蛋白饮食治疗，推荐蛋白质摄入量一般为一日0.6～0.8 g/kg；如肾功能严重受损（GFR每分钟≤30 ml）或蛋白摄入较低（一日0.4～0.6 g/kg），则应补充必需氨基酸制剂（一日0.1～0.2 g/kg）或复方α-酮酸（一次4～5粒，一日3次）。患者必须摄入足够热量，一般为一日30～35 kcal/kg。已接受血液透析或腹膜透析治疗的患者应适当增加蛋白质的摄入量。

（2）控制高血压：降压药物宜选用那些既可有效地控制高血压，又有保护靶器官（心、肾、脑等）作用的药物。主张联合用药，如ACEI（如福辛普利一次10 mg，一日1～2次）或ARB（如厄贝沙坦 一次150 mg，一日1次）加利尿药（如氢氯噻嗪一次25 mg，一日1次；或托拉塞米一次10 mg，一日1次）、长效CCB（如苯磺酸氨氯地平一次5 mg，一日1次）加ACEI或ARB等，若血压仍未达标，可以加用β和（或）α受体拮抗药（如卡维地洛一次20 mg，一日2次）及血管扩张药等，也可选用复方制剂（如氯沙坦氢氯噻嗪片，或厄贝沙坦氢氯噻嗪片，一次1片，一日1次）；血肌酐＞265 μmol/L或GFR每分钟＜30 ml的患者应谨慎使用ACEI或ARB，务必密切监测肾功能和血钾。已经接受血液净化治疗的患者可以选用ACEI或ARB。

（3）纠正肾性贫血：血红蛋白＜100～110 g/L的患者即可开始使用重组人促红素（rhEPO）治疗，一般初始用量为一次2 000～3 000 U，每周2次，皮下注射或静脉注射。直至血红蛋白上升至110～120 g/L为达标。在维持达标的前提下，其后每月调整用量，适当减少rhEPO用量。在应用rhEPO时同时应补充铁剂（口服硫酸亚铁或富马酸亚铁，或静脉补充铁剂），叶酸（一次10 mg，一日3次）、维生素B_{12}（一次0.5 mg，一日1～3次）类药物。

（4）钙磷代谢紊乱和肾性骨病的治疗：当GFR每分钟＜30 ml时，除限制磷摄入外，可应用磷结合药口服，以口服碳酸钙较好，一次0.5～2 g，一日3次，餐中服用。对明显高磷血症（血磷＞2.26 mmol/L）或血清钙磷乘积＞65 mg^2/dl^2者，则应暂停应用钙剂，以防

转移性钙化的加重；此时可短期服用氢氧化铝凝胶或混悬剂（一次 10 ～ 35 ml，一日 3 次），待钙磷乘积 <65 mg^2/dl^2 时，再服用钙剂。对明显低钙血症患者，可口服骨化三醇，一日 0.25μg，连服 2 ～ 4 周；如血钙和症状无改善，可将用量增加至一日 0.5μg；对血钙正常的患者，则宜隔日口服 0.25μg。凡口服钙及活性维生素 D_3 的患者，治疗中均需要监测血钙、磷、甲状旁腺激素浓度，使透析前患者血全段甲状旁腺激素（iPTH）保持在 35 ～ 110 pg/ml（正常参考值为 10 ～ 65 pg/ml）；使透析患者血钙磷乘积尽量接近目标值的低限（Ca × P<55mg²/dl² 或 4.52 mmol²/L²），血 iPTH 保持在 150 ～ 300 pg/ml，以防止生成不良性骨病。对已有不良性骨病的患者，不宜应用骨化三醇或其类似物。

（5）纠正代谢性中毒：主要是补充碳酸氢钠，轻者一日 1.5 ～ 3 g，分 3 次服用；中、重度患者一日 3 ～ 15 g，必要时可静脉输入。可将纠正酸中毒所需之碳酸氢钠总量分 3 ～ 6 次给予，在 48 ～ 72 小时或更长时间后基本纠正酸中毒。对有明显心力衰竭的病人，要防止碳酸氢钠输入过多，输入速度宜慢，以免加重心脏负荷。

（6）水钠代谢紊乱的防治：水肿者应限制盐和水的摄入，也可根据需要应用襻利尿药（如呋塞米、布美他尼、托拉塞米等），呋塞米一次 20 ～ 100 mg，一日 2 ～ 3 次，噻嗪类利尿药及潴钾利尿药对 CRF 病人（Scr > 220μmol/L）不宜应用，因此时疗效甚差。对并发急性左心衰竭患者，常需及时给予血液透析或持续性血液滤过治疗。

（7）高钾血症的防治：首先应积极预防高钾血症的发生。当 GFR 每分钟 < 25 ml（或 Scr>309.4 ～ 353.6 μmol/L）时，即应适当限制钾的摄入。在限制钾摄入的同时，还应注意及时纠正酸中毒。对已有高钾血症的患者，应采取更积极的措施：①积极纠正酸中毒，除口服碳酸氢钠外，必要时（血钾 >6 mmol/L）可静脉给予（静脉滴注或静脉注射）碳酸氢钠 10 ～ 25 g，根据病情需要 4 ～ 6 小时后还可重复给予。②给予襻利尿药，最好静脉注射呋塞米 40 ～ 80 mg（或布美他尼 2 ～ 4 mg），必要时可将剂量增至一次 100 ～ 200 mg，静脉注射。③应用葡萄糖 - 胰岛素溶液输入（葡萄糖 4 ～ 6 g 中，加胰岛素 1U）。④口服降钾树脂（如聚苯乙烯磺酸钙，一次 5 ～ 20 g，一日 3 次，增加肠道钾排出，还能释放游离钙。⑤对严重高钾血症（血钾 > 6.5 mmol/L），且伴有少尿、利尿效果欠佳者，应及时给予血液透析治疗。

（8）促进尿毒症性毒素的肠道排泄：口服吸附剂，如药用炭、包醛氧化淀粉（一次 5 g，一日 3 次）等，也可选用大黄制剂口服或保留灌肠，或尿毒清颗粒等复方大 黄制剂口服。

尿毒症期的患者应接受血液净化治疗。糖尿病肾病所致 CRF 患者的血肌酐≥ 530.4 μmol/L、GFRt ≤ 每分钟 15 ml 时即可考虑进行血透或腹透治疗。

复方肾病用氨基酸（9AA）

Compound Amino Acid for Kidney Disease（9AA）

【适应证】用于急性和慢性肾功能不全患者的肠道外支持；大手术、外伤或脓毒血症引起的严重肾衰竭及急性和慢性肾衰竭。

【注意事项】（1）用药期间，应定期检查血糖、血清蛋白、肾功能、肝功能、电解质、二氧化碳结合力、血钙、血磷，必要时检查血镁和血氨。（2）滴速不超过每分钟 15 滴。（3）凡用本品的患者，均应低蛋白、高热量饮食。热量摄入应为一日 2 000 kcal 以上，如饮食摄入达不到，应给予葡萄糖等补充。（4）尿毒症病人和糖尿病患者宜在补充葡萄糖同时给予适量胰岛素。（5）尿毒症性心包炎、尿毒症脑病、无尿、高钾血症等患者应首先采用透析治疗。（6）注意水平衡，防止血容量不足或过多。（7）用药前应检查药液有无浑浊，如遇冷析出结晶可置于 50℃温水中溶解后再用。

【禁忌证】（1）对本品过敏者；（2）氨基酸代谢紊乱、严重肝功能损害；（3）严重氮质血症、肝性脑病；（4）严重肾功能衰竭或尿毒症患者。

【不良反应】静脉滴注速度过快可引

起恶心、呕吐、心悸、寒战等。

【用法与用量】静脉滴注。成人一日250～500 ml，缓慢滴注。进行透析的急、慢性肾衰竭患者可适当增加用量。滴速不超过每分钟15滴。

【制剂与规格】复方肾病氨基酸注射液：每瓶250 ml。每瓶含氨基酸总量为13.98 g。

（其他见11.1.2.3）

复方α-酮酸片[保(乙)]

Compoundα-Keto Acid Tablets

【适应证】配合低蛋白饮食，预防和治疗因慢性肾功能不全造成蛋白质代谢失调引起的损害。通常用于肾小球滤过率低于每分钟25 ml的患者。低蛋白饮食要求成人一日蛋白摄入量40 g或40 g以下。

【注意事项】(1) 保证足够的热量。成人患者需要一日40 g的蛋白饮食。(2) 肾脏疾病、肾小球滤过率低于每分钟25 ml患者，本品不超过一日40 g的蛋白饮食，可长期服用。本品宜在用餐时服用。(3) 用药期间定期监测血钙水平，并且注意调整用量。

【禁忌证】高钙血症和氨基酸代谢紊乱者。遗传性苯丙酮尿患者使用本品时，须注意本品含有苯丙氨酸。

【不良反应】可能出现高钙血症。个别出现上中腹饱满。

【用法与用量】口服：成人一次4～8片，一日3次，用餐期间整片吞服。对于肾小球滤过率低于每分钟20 ml的患者，本品配合一日不超过40 g（成人）的低蛋白饮食，可长期服用。

【制剂与规格】复方α-酮酸片剂：0.63 g（每片内含消旋酮异亮氨酸钙67 mg，酮亮氨酸钙101 mg，酮苯丙氨酸钙68 mg，酮缬氨酸钙86 mg，消旋羟蛋氨酸钙59 mg，L-赖氨酸醋酸盐105 mg，L-苏氨酸53 mg，L-色氨酸23 mg，L-组氨酸38 mg，L-酪氨酸30 mg。每片总氮量36 mg，总钙量约50 mg）。

重组人促红素[保(乙)]

Recombinant Human Erythropoietin

【适应证】用于肾功能不全所致贫血，包括透析和非透析患者。

【注意事项】(1) 未经透析的肾硬化病人，根据个人病情限定治疗，因它加速肾衰竭进展的可能性不排除。(2) 下列情况慎用：心肌梗死，肺梗死，脑梗死，妊娠期及哺乳期妇女，慢性肝衰竭患者，有药物过敏史及有药物过敏倾向者，合并感染者宜控制感染后使用本品。(3) 老年人注意监测血压及血细胞比容，并适当调整剂量及给药次数。(4) 用药期间应定期检查血红蛋白（用药初期每星期1次，维持期每两星期1次）、血细胞比容、血清钾和磷。注意避免过度的红细胞生成（确认血细胞比容在36 vol%以下）。如发生血钾升高，应遵医嘱调整剂量。(5) 治疗期间因出现有效造血，铁需求量增加。通常出现血清铁浓度下降，如果患者血清铁蛋白低于100 ng/ml，或转铁蛋白饱和度低于20%，应适当补充铁剂。(6) 叶酸或维生素B_{12}缺乏会降低本品疗效，铝过多会影响疗效。(7) 严禁冷冻。

【禁忌证】【不良反应】见6.1.4。

【用法与用量】皮下注射或静脉注射，每周分2～3次给药，给药剂量需依据病人的贫血程度、年龄及其他相关因素调整。(1) 治疗期：①血液透析患者推荐初始剂量每周100～150 U/kg，分2～3次给药。②非透析患者推荐初始剂量每周75～100 U/kg，分2～3次给药。若每周血细胞比容增加少于0.5vol%，可于4周后按15～30 U/kg增加剂量，最高不超过每周增加30 U/kg。血细胞比容应增加到30～33 vol%，但不宜超过36vol%。(2) 维持期：如果血细胞比容达到30～33 vol%或（和）血红蛋白达到100～110 g/L，则进入维持治疗阶段，推荐将剂量调整到治疗剂量的2/3，然后每2～4周检查血细胞比容以调整剂量，避免红细胞生成过速，维持血细胞比容和血红蛋白的适当水平。(3) 采用无菌技术，打开药瓶，将消毒针连接消毒注射器，吸入适

量药液，静脉或皮下注射。如果为预充式注射器包装，拔掉胶盖，直接静脉或皮下注射。

【制剂与规格】重组人促红素注射液：① 1 ml ：1 500 U；② 1 ml ：2 000 U；③ 1 ml ：3 000 U；④ 1 ml ：4 000 U；⑤ 1ml ：6 000 U。

(其他见6.1.4)

药用炭[保(甲)] 作为吸附剂，可用于促进尿毒症性毒素的肠道排泄，以及食物及生物碱等引起的中毒及腹泻、腹胀气等。口服：①成年人一次 0.9 ~ 3 g，一日 3 次。②儿童一次 0.3 ~ 0.6 g，一日 3 次。(其他见 3.8.1)

包醛氧化淀粉(包醛氧淀粉)[保(乙)]

Coated Aldehyde Oxystarch

【适应证】尿素氮吸附药，适用于各种原因造成的氮质血症、尿毒症。

【注意事项】(1) 本品不与胃肠道黏膜直接接触，故无氧化淀粉的胃肠道不良反应。(2) 偶见排便次数增多，减量可逐渐减轻。(3) 药品受潮变黄后勿服用。(4) 本品不宜与碱性药物同服，以免影响其吸附尿素氮的作用。

【用法与用量】口服：一次 5 ~ 10 g，一日 2 ~ 3 次，于餐后用热开水浸泡后服，或用温水冲服，或遵医嘱。

【制剂与规格】包醛氧化淀粉粉剂：5 g。

阿魏酸哌嗪[保(乙)]

Piperazine Ferulate

【适应证】用于各类有镜下血尿和高凝状态的肾小球疾病，如肾炎、慢性肾炎、肾病综合征、早期尿毒症、冠心病、脑梗死和脉管炎等的辅助治疗。

【注意事项】本品禁与阿苯达唑类和双羟萘酸噻嘧啶类药物合用。

【禁忌证】对阿魏酸哌嗪类药物过敏者禁用。

【不良反应】尚未发现有关报道。

【用法与用量】口服：一次 100 ~ 200 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】阿魏酸哌嗪片：50 mg。

8.8 肾移植及其药物治疗

肾移植 (kidney transplantation) 与透析相结合已经成为治疗不可逆慢性肾衰竭的有效措施。为预防移植后排斥反应，接受肾移植的患者除同卵孪生者间肾移位之外均应终身服用免疫抑制药，且应根据供受者配型相符程度、免疫抑制药对受者的疗效及不良反应制定个体化治疗方案，并且术后不同时期也应有不同用药方案。

常用的免疫抑制药有环孢素 (CsA)、他克莫司 (FK506)、吗替麦考酚酯 (MMF) 等。为减少不同药物的不良反应、节省费用及临床病情的变化，常常是 3 种不同作用途径的药物联合应用，即二联、三联、短期四联用药，方案如下：

(1) 二联用药：① CsA 或 FK506 或硫唑嘌呤 (Aza) + 泼尼松或 CsA；② FK506 + Aza。

(2) 三联用药：CsA 或 FK506 + Aza 或 MMF + 泼尼松。

(3) 四联用药：CsA 或 FK506 + Aza 或 MMF + 泼尼松 + 短期使用生物制剂。

肾移植术后 3 个月内，尤其是术后 2 ~ 4 周，是肾移植成功的关键阶段，急性排斥反应大部分都发生在这一时期，为了加强预防移植肾急性排斥反应的效果，移植前就可用药预防。目前最常用的抗排异药物是 CsA 和糖皮质激素。经济条件许可时，可用 FK506 替代 CsA。如果患者有肝功能异常、慢性肝炎，则宜用 MMF 替代 Aza，FK506 替代 CsA，以预防加重肝损害。

移植术后 3 ~ 6 个月，若患者无并发症发生，则进入了维持治疗期间。此期的免疫治疗方案各个移植中心并不相同，往往取决于患者的病情、经济状况及肾移植医生的临床用药经验，大多使用二联、三联治疗。在治疗过程中应特别注意 CsA 或 FK506 的血药浓度，调整药物用量。

环孢素[保(甲)]

Ciclosporin

【适应证】(1) 预防同种异体肾、肝、

心、骨髓等器官或组织移植所发生的排斥反应，也适用于预防及治疗骨髓移植时发生的移植物抗宿主反应（GVHD）。(2) 经其他免疫抑制药治疗无效的狼疮肾炎、难治性肾病综合征等自身免疫性疾病。

【注意事项】(1) 本品由乳汁分泌，对哺乳的婴儿可产生高血压、肾毒性、恶性肿瘤等潜在危险，故服用本品的母亲不得哺乳。(2) 下列情况慎用：孕妇，肝肾功能不全者，高钾血症、感染、肠道吸收不良和对本品不耐受者等。(3) 儿童用量可按或稍大于成人剂量计算。(4) 老年人因易合并肾功能不全，故应慎用本品。(5) 用药期间，定期检测肝、肾功能和监测血药浓度，以调整用药剂量。还应定期检查血压、血脂、血钾和镁。(6) 本品经动物实验证明有增加致癌的危险性。人类也有并发淋巴癌、皮肤恶性肿瘤的报道，但尚无导致诱变性的证据。(7) 若本品已引起肾功能不全或有持续负氮平衡，应立即减量或停用。(8) 若发生感染，应立即用抗生素治疗，本品亦应减量或停用。(9) 在预防治疗器官或组织移植排斥反应及治疗自身免疫性疾病方面，本品的剂量常因治疗疾病、个体差异用本品后的血药浓度不相同而并不完全统一，小儿对本品的清除率较快，故用药剂量可适当加大。

【禁忌证】对环孢素及任何赋形剂过敏、严重肝肾损害、未控制的高血压、感染及恶性肿瘤者，孕妇和哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 常见厌食、恶心、呕吐、齿龈增生伴出血、疼痛，约1/3用药者有肾毒性，可出现血清肌酐及尿素氮增高、肾小球滤过率减低等肾功能损害、高血压等。牙龈增生一般在停药6个月后消失。慢性、进行性肾中毒多于治疗后约12个月发生。(2) 少见惊厥，其原因可能与本品对肾毒性及低镁血症有关。此外本品尚可引起ALT及AST升高、胆汁淤积、高胆红素血症、高血糖、多毛症、手震颤、高尿酸血症伴血小板减少、溶血性贫血、四肢感觉异常、下肢痛性痉挛等。此外，有报道本品可促进ADP诱发血小板聚集，增加血栓烷 A_2 的释放和凝血活酶的生成，增强因子Ⅶ的活性，减少前列环素产生，诱发血栓形成。(3) 罕见胰腺炎、白细胞减少、雷诺综合征、糖尿病、血尿等（过敏反应一般只发生在经静脉途径给药的患者，表现为面颈部发红、气喘、呼吸短促等）。产生各种不良反应大多与使用剂量过大有关，预防的方法是经常监测本品的血药浓度，调节本品的全血浓度，使维持在临床能起免疫抑制作用而不致有严重不良反应的范围内。有报道认为如在下次服药前测得的本品全血谷浓度为100～200 ng/ml，则可达上述效应。如发生不良反应，应立即给予相应的治疗，并减少本品的用量或停用。

【用法与用量】下列剂量范围仅作为用药的参考。环孢素血浓度的常规监测是很重要的，该结果可用来决定本品的剂量，以达到预期的血药浓度。除了某些情况需静脉滴注外，对大部分病例，推荐口服治疗。(1) 成人：①用于器官移植。采用三联免疫抑制方案时，起始剂量一日6～11 mg/kg并根据血药浓度调整剂量，根据血药浓度每2周减量一日0.5～1 mg/kg，维持剂量一日2～6 mg/kg，分2次口服。在整个治疗过程，必须在有免疫抑制治疗经验医生的指导下进行。②用于骨髓移植。预防GVHD时移植前一天起先用环孢素注射液，一日2.5 mg/kg，分2次静脉滴注，待胃肠反应消失后（0.5～1个月），改服本品，起始剂量一日6 mg/kg，分2次口服，1个月后缓慢减量，总疗程半年左右。治疗GVHD时，单独或在原用糖皮质激素基础上加用本品，一日2～3 mg/kg，分2次口服，待病情稳定后缓慢减量，总疗程半年以上。③用于狼疮肾炎、难治性肾病综合征。初始剂量一日4～5 mg/kg，分2～3次口服，出现明显疗效后缓慢减量至一日2～3 mg/kg，疗程3～6个月以上。(2) 儿童用量可按或稍大于成人剂量计算。（按每日公斤体重计算）。

【制剂与规格】环孢素胶囊：① 10 mg；② 25 mg；③ 50 mg；④ 100 mg。

环孢素注射液：5 ml：250mg。

环孢素口服液（微乳化溶液）：50 ml：5 g。

吗替麦考酚酯[保(乙)]

Mycophenolate Mofetil

【适应证】用于预防同种肾移植病人的排斥反应及治疗难治性排斥反应，可与环孢素和糖皮质激素同时应用。

【注意事项】(1) 肝脏疾病：在酒精性肝硬化志愿者，肝脏实质疾病对MPA的糖苷酸化过程相对无影响，严重的胆道损害，如原发性胆汁性肝硬化，可能对这一过程产生影响。(2) 肾脏疾病：①严重慢性肾功能损害（肾小球滤过率＜每分钟25 ml)，病人服用单剂量吗替麦考酚酯胶囊后，血浆麦考酚酸（MPA）和MPA的酚化葡萄糖苷糖（MPAG）的曲线下面积，比轻度肾功能损害病人及健康人高，应避免使用超过一次1 g、一日2次的剂量，并且应对这些病人密切观察。②移植后肾移植功能延迟的病人，平均0～12小时MPA曲线下面积与正常恢复病人相仿，但MPAG 0～12小时曲线下面积前者比后者高2～3倍。对这些肾功能延迟恢复的病人无需调整剂量，但应被密切观察。(3) 对大鼠的研究发现本品可从乳汁中分泌。哺乳妇女不宜用。(4) 下列情况慎用：肝、肾、心严重功能不全者。(5) 接受肝脏同种异体移植的儿童患者安全性及有效性尚未确定。(6) 与年轻人相比，老年人可能不良反应更多，剂量选择慎重。(7) 在用药期间宜定期（每1～3个月）监测血常规、肝功能等。第一个月每周1次进行全血细胞计数，第二和第三个月每月2次，余下的1年中每月1次。如果发生中性粒细胞减少（中性粒细胞绝对计数$<1.3\times10^9$/L)，本品应停止或减量使用，并对这些病人密切观察；本品出现ALT升高不超过正常值3倍且不伴黄疸者可以继续用，但应追踪观察，如不恢复则需停药。(8) 接受免疫抑制疗法的病人常采用联合用药的方式，(9) 服用本品作为联合应用免疫抑制药物时，有增加淋巴瘤和其他恶性肿瘤（特别是皮肤癌）发生的危险。免疫系统的过度抑制也可能对感染的易感性增加。(10)本品起效时间较长，一般为3～6个月，因此，判断药物的有效性宜在服用规定剂量的3个月以后。(11) 本品不能与硫唑嘌呤同时使用，因对这两种药物的同时使用尚未进行试验。(12) 妊娠妇女避免使用本品，除非对胎儿潜在益处大于潜在危险。

【禁忌证】对吗替麦考酚酯和麦考酚酸有超敏反应者。吗替麦考酚酯静脉制剂禁用于对聚山梨醇酯80（吐温80）有超敏反应的患者。

【不良反应】(1) 消化系统：结肠炎（有时由巨细胞病毒属引起），胰腺炎。(2) 免疫抑制紊乱：严重的威胁生命的感染，例如脑膜炎和感染性心内膜炎，偶有报道，有证据表明一定类型的感染如结核和非典型微生物感染有较高的发生频率。(3) 呼吸系统：肺间质异常，包括致命的肺纤维化少有报道，但在移植后服用吗替麦考酚酯胶囊的患者中如出现呼吸困难、呼吸衰竭等肺部症状时，应考虑从此方面加以诊断。

【用法与用量】(1) 成人：①预防排斥，应于移植72小时内开始服用。肾移植病人服用推荐剂量为一次1 g，一日2次。口服本品一日2 g比一日3 g安全性更好。②治疗难治性排斥，在临床实验中，治疗难治性排斥的首次和维持剂量推荐为一次1.5 g，一日2次。(2) 如果发生中性粒细胞减少（中性粒细胞计数绝对值＜1.3×10^9/L)，应减量或停止。(3) 严重肾功能损害：对有严重慢性肾功能损害的病人（肾小球滤过率＜每分钟25 ml/1.73 m^2)，应避免超过一次1 g、一日2次的剂量（移植后即刻使用除外），对这些病人应仔细观察。对移植后肾功能延期恢复的病人不需要做剂量调整或遵医嘱。(4) 老人（≥65岁）：肾移植病人推荐的常用剂量对老年人是合适的，但要根据老年患者的实际情况合理调整给药剂量。

【制剂与规格】吗替麦考酚酯胶囊：① 250 mg；② 500 mg。

吗替麦考酚酯分散片：① 250 mg；② 500 mg。

注射用吗替麦考酚酯：500 mg。

他克莫司[保(乙)]

Tacrolimus

【适应证】用于预防肝、肾脏移植术

后的排斥反应，治疗肝脏及肾脏移植术后应用其他免疫抑制药无法控制的排斥反应。

【注意事项】(1) 注射制剂内含有聚乙烯氢化蓖麻油，能引起过敏反应。(2) 肝功能异常的患者有较高的血药浓度（相对较长的半衰期和较低的清除率），需监测全血浓度，并需调整使用剂量。(3) 本品几乎完全代谢，脂溶性高且分子量为822，可预计无法用透析排除。此外，给予单一剂量静脉注射后，进入尿里的药物<1%，肾衰竭患者或肾透析的患者并不需要调整剂量。但如果是本药引起的肾功能异常，则需调整剂量。(4) 2岁以下的儿童患者在用本品前应作有关ENV血清学方面的检查。(5) 老年人用药的临床资料较少，但均提示应与成人剂量相同。(6) 用药期间应监测血压、心电图、视力、血糖、血电解质（尤其是钾）、肌酐、BUN、尿量、血液学指标、凝集试验及肝肾功能，如有必要应降低本品用量。(7) 心室肥厚、室间隔增厚及某些少见的心脏病均有报道，通常在药物减量或停药后能缓解，这些情况多数发生在血药浓度过高的儿童患者。对于这些高危人群应该进行超声心动图检查，如病情进一步发展，应考虑药物减量或停药。(8) 对于一些神经系统并发症或中枢神经系统并发症也应考虑进行药物剂量调整。如发现患者有视力改变或神经系统功能障碍，应建议患者不要开车或进行危险的操作。(9) 避免与环孢素一起应用，因此时环孢素的半衰期被延长。在从环孢素换用本品治疗时，尤其应该谨慎，在转换前后均要检测环孢素血药浓度。(10) 长时间暴露在阳光下或行日光浴的患者要使用防晒霜。(11) 本品会使免疫接种的效果下降，应避免使用减毒疫苗。(12) 本品能干扰口服避孕药的代谢，应改用其他方式避孕。

【禁忌证】对本品或其他大环内酯类药物过敏者、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 对病毒、细菌、真菌和（或）原虫感染的易感性增加。(2) 整个治疗期间都会出现肾功能异常（血肌酐升高、尿素氮升高、尿量减少），应注意与排斥反应区分。(3) 内分泌系统：高血糖和糖尿病。(4) 中枢神经系统：频发震颤、头痛、感觉异常和失眠，大多数为中等程度，不影响日常活动；其他如不安、焦虑和情绪不稳等单独出现或同时出现。伴肝功能损害者出现重度神经症状的危险性高，用潜在的神经毒药物和感染都可导致这些症状。(5) 心血管系统：常出现高血压，血药浓度超过25 ng/ml时出现肥厚性心肌病，剂量减少或停药后可以恢复。(6) 血液系统：贫血、凝血、血小板减少、白细胞增生或减少和全血细胞减少症。(7) 高血钾或低血钾、低血镁、高血尿酸、胃肠道症状（如便秘、脱水）、肝功能检查异常和黄疸、关节痛、肌痛和淋巴细胞增生等。

【用法与用量】(1) 口服：胶囊一日2次，于餐前1小时或餐后2～3小时以水送服。如有必要可将胶囊内容物悬浮于水，经鼻饲管给药。建议剂量只有起始剂量，然后在治疗过程中应由临床判定并辅以本品血中浓度的监测以调整剂量。无论是成人还是儿童，本品血药浓度维持20 ng/ml以下均有效。临床实践中，术后早期的2小时血药谷浓度一般维持在5～20 ng/ml。①成人：肝移植患者，初始剂量应为一日0.1～0.2 mg/kg，分2次口服，术后6小时开始用药；肾移植患者，初始剂量应为一日0.15～0.3 mg/kg，分2次口服，术后24小时内开始用药；对传统免疫抑制药治疗无效的排斥反应：发生了排斥反应，且对传统免疫抑制药治疗无效的患者，应开始给予本品治疗，推荐的起始剂量同首次治疗方案。患者由环孢素转换成本品，本品的首次给药间隔时间不超过24小时；如果环孢素的血药浓度过高，应进一步延缓给药时间；由于本品半衰期长，剂量调整后需几日血药浓度才能有变化。②肝功能不全的患者：对术前及术后肝功能不全的患者必须减量，如早期移植物失去功能。③肾功能不全的患者：无须调整剂量。然而建议应仔细监测肾功能，包括血清肌酐值，计算肌酐清除率及监测尿量。血液透析不能减少本品的血中浓度。④老年患者：有限的研究认为与成人用量相同。⑤儿童：通常需要建议成人剂量的1.5～

2倍，才能达到相同的治疗血浓度（肝功能、肾功能受损者情况除外）。用于肝脏及肾脏移植为一日 0.3 mg/kg，分 2 次给药。(2) 静脉注射：假如患者的临床状况不适于口服给药，则应该给予连续 24 小时的静脉输注。他克莫司治疗给药输注用浓缩液必须在聚乙烯或玻璃瓶中用 5% 葡萄糖注射液或者 0.9% 氯化钠注射液稀释。所形成的最终输注用溶液的浓度必须在 0.004～0.1 mg/ml 范围。①成人：肝移植患者一日 0.01～0.05 mg/kg，24 小时持续滴注，术后约 6 小时开始使用；患者情况允许，应尽快改为口服。肾移植患者一日 0.05～0.10 mg/kg，24 小时持续滴注，患者情况允许即改为口服给药。②儿童：通常需要成人建议剂量的 1.5 ～ 2 倍，才能达到相同的治疗血浓度（肝功能、肾功能受损者情况除外）。起始静脉剂量肝移植患者为一日 0.05 mg/kg，肾移植患者为一日 0.1 mg/kg，持续 24 小时滴注。

【制剂与规格】他克莫司胶囊：① 0.5 mg；② 1 mg；③ 5 mg。

他克莫司注射液：1 ml : 5 mg。

西罗莫司[保（乙）]

Sirolimus

【适应证】与环孢素和皮质激素联合使用，预防肾移植后的器官排斥反应。

【注意事项】(1) 应用免疫抑制药增加对感染的易感性和患淋巴瘤的可能性，仅限于有经验的医生在免疫治疗中和器官移植病人的处理中使用西罗莫司。(2) 应定期检测肾功能，在血清肌酐升高的患者中应考虑对免疫抑制方案做适当的调整。与对肾功能有损害的药物一起应用时应密切关注肾功能的变化。(3) 在小于 13 岁孩童身上的安全性和有效性未确定。大于 65 岁的老年患者应在临床医生的指导下应用本品。

【禁忌证】以下患者禁用本品：①西罗莫司及衍生物或含其成分的药物过敏的患者。②严重肝功能受损的病人。③孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】可见高血脂、高血压、皮疹、痤疮、贫血、关节痛、腹泻、低血钾、血小板减少等。三酰甘油和胆固醇的升高、血小板和血红蛋白的减少与西罗莫司的给药剂量有关，维持剂量小于一日 2 mg 的患者不良反应发生率显著降低。

【用法与用量】应用口服给药专用注射器从瓶中抽取所需量的西罗莫司口服液，注入盛有至少 60 ml 水或橘汁的玻璃或塑料容器中，用力搅拌后立即服用。然后另外用 120 ml 水或橘汁再放入此容器中，用力搅拌立即服用。(1) 应在术后 72 小时内和环孢素及糖皮质激素一起应用，一日 1 次。对于接受移植的患者首次应给予维持剂量 3 倍的负荷量，在肾移植者推荐的维持剂量为一日 2 mg，负荷量为 6 mg。应定期根据全血谷浓度调整剂量。根据国内西罗莫司临床试验结果，建议西罗莫司全血谷浓度术后 0 ～ 3 个月控制在 5～10 ng/ml，4～6 个月控制在 3～8 ng/ml。(2) 在体重 < 40 kg 而年龄 ≥ 13 岁的患者需调整剂量，维持量应为一日 1 mg/m^2，负荷量应为 3 mg/m^2。(3) 肝功能受损的患者，维持量应减少 1/3，而负荷量则不变。肾功能异常的患者不需调整剂量。(4) 为使西罗莫司在体内的浓度更加恒定，在应用期间，应固定服药与进食的关系，或每次均空腹服药，或每次均与食物同服。本品只能用水或橘汁稀释后服用。(5) 本品应在环孢素口服液或环孢素胶囊给药后 4 小时服用。

【制剂与规格】西罗莫司口服液：① 50 ml : 50 mg；② 20 ml : 20 mg。

咪唑立宾[保（乙）]

Mizoribine

【适应证】用于抑制肾移植时的排斥反应。

【注意事项】(1) 肾功能损害者的排泄可能延迟，有时引起骨髓功能抑制等严重不良反应，故应考虑肾功能（血清肌酐值等）及年龄、体重等，从低剂量开始给药。骨髓功能抑制患者（有可能加重骨髓功能抑制，出现严重感染症、出血倾向等）；合并细菌、病毒、真菌等感染症患者（因骨髓功能抑制，有可能加重感染症）；出血素质患者（因骨髓功能抑制，有可能出现出血倾向）；肾损害患者慎用。(2) 应进行血液检查、肝功能及肾功能检查等。

(3) 若出现异常，应减量或停药等适当处置。(4) 注意感染症及出血倾向的出现或恶化。若出现异常，应停药并适当处置。(5) 因抑制嘌呤合成作用，有时会增加尿酸生成而出现尿酸水平升高。(6) 儿童及育龄患者有必要用药时，应考虑对性腺的影响。(7) 尚未确立哺乳期用药的安全性，因此哺乳期妇女给药时，应停止哺乳。

【禁忌证】(1) 对本品有严重过敏史者。(2) 白细胞计数在 3 000/mm^3。(3) 孕妇或可能妊娠的妇女禁用。

【不良反应】主要有腹痛、食欲缺乏等消化系统症状、白细胞减少等血液系统障碍、皮疹等过敏症状等。严重不良反应有：①抑制骨髓功能：可出现白细胞减少、血小板减少、红细胞减少、血细胞比容降低等；②感染症：有时出现肺炎、脑膜炎、败血症、带状疱疹等；③间质性肺炎：极少。肾损害患者给药后可能随尿酸值上升而出现急性肾衰竭，应停药并进行血液透析等适当处置。其他不良反应有：肾功能异常（蛋白尿、血尿、BUN、肌酐上升等），肝功能异常（ALT、AST、ALP、LDH、γ-GTP、LAP、胆红素上升等），消化系统（食欲缺乏、恶心、呕吐、腹泻、腹痛、腹胀、消化道出血、消化性溃疡、便秘、口内炎、舌炎。过敏症：皮疹、瘙痒感、发热），代谢异常（高血糖、糖尿、尿酸值上升）、皮肤（脱毛发），神经精神系统（眩晕、头痛、味觉异常），其他（全身乏力、水肿、口渴、丙种球蛋白降低、心悸）。接受免疫抑制药治疗的患者，有恶性肿瘤（尤其淋巴瘤、皮肤癌等）发生率高的报告。

【用法与用量】口服：初始用量一日 2 ~ 3 mg/kg，维持量一日 1 ~ 3 mg/kg，分 1 ~ 3 次服用。本品耐药量及有效量随患者有异，为取得最适治疗效果，有必要慎重增减用量。

【制剂与规格】咪唑立宾片：① 25 mg；② 50 mg。

8.9 泌尿和男性生殖系统感染及其药物治疗

泌尿和男性生殖系统感染（urinary tract infection，UTI）可以根据感染发生部位分为上尿路感染如肾盂肾炎（pyelonephritis）和下尿路感染如膀胱炎（cystitis）、前列腺炎（prostatitis）、尿道炎（urethritis）、附睾炎（epididymitis）或睾丸炎（orchitis）。由于泌尿生殖系统的各个部分在一定程度上是相通的，因而一个部位的感染可能同时出现在另一个部位。

微生物致病源可以通过血行或淋巴途径致病，但多数 UTI 是由尿道上行所致，特别是肠道来源的致病菌如大肠埃希菌和其他肠道致病菌。致血行感染的病菌包括葡萄球菌属，念珠菌属，沙门菌和肺结核分枝杆菌等，也可以导致 UTI。

8.9.1 泌尿和男性生殖系统非特异性感染的药物治疗

可分为非复杂性下尿路感染，如膀胱炎、非复杂性肾盂肾炎及伴或不伴肾盂肾炎的复杂性泌尿生殖系统感染、泌尿脓毒血症、尿道炎和特殊的形式如前列腺炎、附睾炎和睾丸炎。

(1) 上尿路感染的药物治疗

对于轻度和中度的患者给予口服氟喹诺酮类药物 7 日作为一线治疗。如果不适宜应用氟喹诺酮类药物，可用三代头孢菌素如头孢泊肟作为替代用药。如果有革兰阳性菌存在，推荐应用青霉素类加 β 内酰胺酶抑制药。如果病情严重，患者需要住院治疗。若不能口服，应该通过注射给药，如氟喹诺酮类药物、青霉素类加 β 内酰胺酶抑制药、三代头孢菌素或氨基糖苷类。病情改善后可以改为口服给药完成 1 ~ 2 周的疗程。

复发性 UTI 定义为过去的 12 个月中发生了 3 次或 6 个月内发生 2 次 UTI。药物预防建议长期有规律睡前或性活动后服用抗菌药（表 8-1）。起始治疗为 4 ~ 6 周，并且视病情进展调整用药时间。但预防用药并不能改变疾病的自然病程，停药后，有 60% 的患者发生复发。

对抗菌药物治疗无效的患者应进行全面泌尿系统检查，如发现伴有尿路解剖畸形或功能异常，应予以治疗。

表 8-1 复发性 UTI 推荐用药（睡前服用）

药 物	剂 量
标准用药	
呋喃妥因	一日 50 mg
磺胺甲噁唑 / 甲氧苄啶（SMZ-TMP）（每片含 400 mg/80 mg）	一日 200 mg/40 mg
甲氧苄啶	一日 100 mg
磷霉素	一日 3 g
暴发感染用药	
环丙沙星	一日 125 mg
诺氟沙星	一日 200～400 mg
妊娠期间用药	
头孢氨苄	一日 125 mg
头孢克洛	一日 250 mg

（2）下尿路感染的药物治疗

如果怀疑下尿路感染，要进行尿常规检查以确定是否存在脓尿和血尿。传统诊断菌尿的标准是患者尿菌落计数超过 10^5/ml。通常尿培养并不是十分必要，因为致病菌和药物敏感状况很容易预测。只有那些症状不典型的 UTI 患者需要接受尿培养检查，以发现一些非常见病菌。

推荐甲氧苄啶（TMP）、磺胺甲噁唑甲氧苄啶、喹诺酮类、β 内酰胺酶抑制药、磷霉素和呋喃妥因等药（任选一种）。治疗期限方面，单剂量给药清除菌尿的疗效显著低于长期用药。长期用药通常有更好的治疗结果。但甲氧苄啶、磺胺甲噁唑甲氧苄啶、诺氟沙星，环丙沙星和氟罗沙星给药 3 日取得的临床效果与长期用药是一样的。

3 日磺胺甲噁唑甲氧苄啶治疗方案被认为是标准治疗。也有近期的研究显示 5 ～ 7 日的疗程效果更好。3 日喹诺酮类药物治疗方案取得的疗效与 TMP-SMZ 相同。β 内酰胺酶抑制药在治疗急性膀胱炎方面较上述 2 种药物差。有研究结果显示匹美西林一次 200 mg、一日 2 次、连续 7 日的疗效与诺氟沙星一次 400 mg、一日 2 次的疗效相同。总体上，第一代和第二代口服头孢菌素类不推荐作为治疗急性膀胱炎的一线治疗。但第三代口服头孢菌素如头孢泊一次 200 mg、一日 2 次如同 TMP-SMZ 一样安全有效。3 ～ 7 日的磷霉素可以取得 86.7% 的清除菌尿疗效。建议 5 ～ 7 日疗程的呋喃妥因（一次 50 ～ 100 mg，一日 4 次）治疗急性膀胱炎。急性膀胱炎推荐用药见表 8-2。

磷霉素 [保（甲／乙）]

Fosfomycin

【适应证】用于对本品敏感的致病菌所引起的下尿路感染，如膀胱炎、尿道炎。

【注意事项】肝病患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】常见腹泻、软便，偶见皮疹、恶心，停药后可消失。

【用法与用量】口服。成人一次 5.631 g，一日 1 次，空腹服用。以适量水溶解后服，或遵医嘱。

【制剂与规格】磷霉素氨丁三醇散：5.631 g（相当于磷霉素酸 3 g）。

表 8-2 急性膀胱炎推荐用药

药 物	剂 量	疗 程
头孢泊肟	一次 100 mg，一日 2 次	3 ～ 7 日
环丙沙星	一次 250 mg，一日 2 次	3 ～ 7 日
磷霉素氨丁三醇	一次 3 000 mg，一日 1 次	3 ～ 7 日
左氧氟沙星	一次 250 mg，一日 1 次	3 ～ 7 日
呋喃妥因	一次 50 ～ 100 mg，一日 3 次	5 ～ 7 日
诺氟沙星	一次 400 mg，一日 2 次	3 ～ 7 日
氧氟沙星	一次 200 mg，一日 2 次	3 ～ 7 日
匹美西林	一次 200 mg，一日 2 次	7 日
甲氧苄啶	一次 200 mg，一日 2 次	5 ～ 7 日
磺胺甲噁唑 / 甲氧苄啶（每片含 400 mg/80 mg）	一次 2 片，一日 2 次	3 ～ 7 日

匹美西林

Pivmecillinam

【适应证】用于泌尿系统感染，亦用于呼吸道感染、肠道感染以及伤寒等。

【禁忌证】应用前须做青霉素过敏试验，对过敏者禁用。

【不良反应】可见过敏反应，如荨麻疹、皮疹等，另可见恶心、呕吐、腹泻、腹部不适等反应。

【用法与用量】口服：①成人一日 0.5 ~ 1 g，分 2 ~ 4 次给予；②儿童一日 20 ~ 40 mg/kg，分 3 ~ 4 次给予，重症可加大剂量。

【制剂与规格】盐酸匹美西林片：0.25 g。

盐酸匹美西林胶囊：0.25 g。

8.9.2 泌尿和男性生殖系统结核的药物治疗

泌尿和男性生殖系统结核多原发于肾结核，经尿液传播至输尿管、膀胱、前列腺、输精管和附睾等器官。确诊后即应给予常规抗结核药治疗。如被侵器官破坏严重，无法恢复和功能丧失者（包括全肾钙化的所谓自家肾切除的肾脏），宜在抗结核药物治疗 2 ~ 4 周后行病灶切除手术。术后仍需持续抗结核药物治疗，视病情应用 6 ~ 12 个月。由于结核菌易产生耐药，故主张联合用药。肾结核治疗过程中应观察输尿管梗阻状况，必要时放置内引流支架管，以保持疗效和功能。应用链霉素易发生纤维化瘢痕，引起尿路梗阻，故目前除急性期外一般不选用。

根据 WHO 建议，抗结核药物治疗是在开始 2 个月强化治疗基础上进行的。强化治疗为同时用 3 或 4 种药物（利福平、异烟肼、吡嗪酰胺、乙胺丁醇或链霉素）以杀灭所有的结核杆菌。强化治疗后是 4 个月的持续治疗期。其间只用 2 种药物，常用利福平和异烟肼，可一周 2 ~ 3 次。另外泌尿、生殖系统结核药治疗是一线治疗，现在的治疗期限已经缩短到 6 个月，而不是 40 年前的 24 个月。只是在复杂的病例，治疗期限才延长到 9 ~ 12 个月。不容忽视的是，目前存在耐药菌株。大部分只耐 1 种药物，也有耐 4 种药物的菌种。如果发生了耐药的情况，就需要从二线用药中挑选替代用药（乙硫异烟胺、丙硫异烟胺、氟喹诺酮类、克拉霉素、环丝氨酸、紫霉素和卷曲霉素）。二线药的不良反应要比一线药大。治疗泌尿生殖系统结核的药物剂量见表 8-3。

本节所涉及的抗结核药物见第 9 章感染疾病用药。

8.10 膀胱过度活动症及其药物治疗

膀胱过度活动症（overactive bladder，OAB）是一种以尿急症状为特征的症候群，常伴有尿频和夜尿症状，可伴或不伴有急迫性尿失禁。OAB 无明确的病因，不包括由急性尿路感染或其他形式的膀胱尿道局部病变所致的症状。目前应用于 OAB 的治疗药物主要是 M 受体拮抗药，

表 8-3 治疗泌尿生殖系统结核的药物剂量

抗结核药物	剂量（mg/kg）	体 重	一日剂量
异烟肼（INH）	5	<50 kg	300 mg
利福平（RMP）	10	>50 kg	450 ~ 600 mg
吡嗪酰胺（PZA）	25 ~ 35	<50 kg	1.5 g
		50 ~ 75 kg	2 g
		>75 kg	2.5 g
链霉素（SM）	15 ~ 20	<50 kg	0.75 g
		>50 kg	2 g
乙胺丁醇（EMB）	25	<50 kg	0.8 ~ 2 g
		>50 kg	2 g
丙硫异烟胺（PTA）	5 ~ 15		0.5 ~ 1 g

如托特罗定。M受体拮抗药主要通过阻断膀胱壁组织中的M受体、抑制逼尿肌收缩，达到缓解膀胱过度活动所引起的尿频、尿急以及急迫性尿失禁等症状的目的。OAB的治疗原则是缓解症状，提高生活质量。目前临床的首选治疗药是托特罗定。

托特罗定 [保(乙)]

Tolterodine

【适应证】用于因膀胱过度兴奋引起的尿频、尿急或紧迫性尿失禁症状的治疗。

【注意事项】(1) 肾功能低下者慎用。(2) 肝功能明显低下的患者，每次剂量不得超过1mg。(3) 孕妇慎用。(4) 哺乳期妇女不宜服用本品。(5) 无儿童用药经验，不推荐儿童使用。(6) 下列情况慎用：自主神经疾病、裂孔疝患者、膀胱出口梗阻和胃肠道梗阻者。(7) 可能引起视物模糊，司机和危险作业者应当注意。

【禁忌证】(1) 尿潴留、胃滞纳、未经控制的闭角型青光眼患者。(2) 已证实对本品有过敏反应者。(3) 重症肌无力、严重的溃疡性结肠炎、中毒性巨结肠患者。

【不良反应】常见口干、消化不良、便秘、腹痛、胀气、呕吐、头痛、眼干燥症、皮肤干燥、嗜睡、神经质；少见胸痛、过敏反应、尿闭、精神障碍。

【用法与用量】口服：(1) 成人初始的推荐剂量为一次2mg，一日2次。根据病人的反应和耐受程度，剂量可下调到一次1mg，一日2次。(2) 对于肝功能明显低下和正在服用CYP3A4抑制药者，推荐剂量为一次1mg，一日2次。

【制剂与规格】酒石酸托特罗定片：①1mg；②2mg。

酒石酸托特罗定胶囊：2mg。

酒石酸托特罗定缓释片：4mg。

黄酮哌酯 [保(甲)]

Flavoxate

【适应证】用于下列疾病引起的尿频、尿急、尿痛、排尿困难以及尿失禁等症状：①下尿路感染性疾病（膀胱炎、前列腺炎、尿道炎等）。②下尿路梗阻性疾病（早、中期前列腺增生症，痉挛性、功能性尿道狭窄）。③下尿路器械检查后或手术后（前列腺摘除术、尿道扩张、膀胱镜内手术）。④尿道综合征。⑤急迫性尿失禁。

【注意事项】(1) 孕妇使用的安全性尚未确定，故应慎用。(2) 12岁以下儿童不宜使用。(3) 下列情况慎用：青光眼、白内障及残余尿量较多者。(4) 伴有炎症的患者应同时加用抗感染药物。(5) 勿与大量维生素C或钾盐合用。

【禁忌证】胃肠道梗阻或出血、贲门失弛缓症、尿道阻塞失代偿者，有神经精神症状者及心肝肾功能严重受损者，司机及高空作业人员。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、嗜睡、口干、视物模糊和调节麻痹、眼压增高、排尿困难、心动过速、心悸等。

【用法与用量】口服。一次0.2g，一日3～4次，病情严重时可适当增加用量。

【制剂与规格】盐酸黄酮哌酯糖衣片：0.2g。

奥昔布宁 [保(乙)]

Oxybutynin

【适应证】用于膀胱炎、尿道炎、尿路感染及各种原因所致的尿频、尿急、夜尿和尿失禁等症状。

【注意事项】(1) 肝肾疾病患者，5岁以下儿童，老年人，妊娠期妇女，自主神经疾病、伴有食管裂孔疝的消化性食管炎、回肠和结肠造口术的患者慎用。(2) 司机、机器操作、高空作业人员及从事危险工作的人员在使用本品时，应告知可能产生视物模糊或瞌睡等症状。(3) 伴有感染的患者，应合并使用相应的抗菌药物。(4) 溃疡性结肠炎患者，大剂量使用可能抑制肠蠕动而产生麻痹性肠梗阻。(5) 甲状腺功能亢进、冠心病、充血性心力衰竭、心律失常、高血压及前列腺肥大等患者使用本品后，可加重症状。

【禁忌证】青光眼患者、部分或完全胃肠道梗阻、麻痹性肠梗阻、老年或衰弱病人的肠张力缺乏、重症肌无力患者、阻塞性尿道疾病及处于出血性心血管状态不稳定的患者。

【不良反应】偶见口干、面部潮红，2～3周后可自行消失。

【用法与用量】口服：①成人一次

5 mg，一日 2 ~ 3 次；最大剂量为一次 5 mg，一日 4 次或遵医嘱。② 5 岁以上儿童常用量一次 5 mg，一日 2 次；最大剂量，一次 5 mg，一日 3 次或遵医嘱。

【制剂与规格】盐酸奥昔布宁片：5 mg。

非那吡啶[保(乙)]

Phenazopyridine

【适应证】用于缓解由膀胱炎、前列腺炎、尿道炎、淋病性尿道炎及内镜检查、尿道插管等所引起的尿道及膀胱疼痛、灼热感和尿频、尿急等不适。

【不良反应】(1) 胃肠不适、头痛、皮疹。(2) 曾报道出现贫血、中性粒细胞减少症、血小板减少症、肾结石及肾毒性反应。

【用法与用量】口服：成人，一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 3 次，餐后服用。9 ~ 12 岁儿童：一次 0.1 g，一日 3 次。

【制剂与规格】盐酸非那吡啶片：0.1 g。

8.11 前列腺增生及其药物治疗

良性前列腺增生（benign prostatic hyperplasia，BPH）是中老年男性导致下尿路症状（lower urianry tract symptoms，LUTS）的最常见病因，主要表现为尿频、尿急、排尿困难、夜尿增多、充盈尿失禁及急、慢性尿潴留等症状。

良性前列腺增生患者药物治疗的短期目标是缓解患者的下尿路症状，提高生活质量。长期目标是延缓疾病的临床进展，预防或延缓急性尿潴留等并发症的发生和对外科手术的需要。药物治疗效果不满意、病情严重时需手术治疗。

良性前列腺增生的治疗药主要包括 α_1 受体拮抗药、5α-还原酶抑制药以及植物制剂等。

8.11.1 α_1 受体拮抗药

α_1 受体拮抗药治疗良性前列腺增生的原理是通过阻断前列腺和膀胱颈平滑肌细胞的 α_1 受体，降低平滑肌张力和尿道压力，达到改善良性前列腺增生临床症状的目的。

多沙唑嗪[保(乙)]

Doxazosin

【适应证】用于良性前列腺增生、高血压的治疗。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(3) 本品可能出现头晕、疲劳（特别是刚治疗开始时）、嗜睡，可能导致反应能力下降，从事驾驶或机械操作者应谨慎。(4) 本药首次服用、加量或停药数日后再次用药常会出现明显的直立效应。(5) 在治疗良性前列腺增生前，应先排除前列腺癌。

【禁忌证】已知对喹唑啉类或本品的任何成分过敏者、近期发生心肌梗死者、已接受本品治疗者如发生心肌梗死，应针对个体情况决定其梗死后治疗。有胃肠道梗阻、食管梗阻或任何程度胃肠道腔径缩窄病史者禁用。

【不良反应】常见直立性低血压、头晕、乏力、外周性水肿、呼吸困难、头痛、全身不适、直立性头晕、眩晕、虚弱、嗜睡、腹痛、腹泻、恶心、呕吐、胃肠炎、口干、背痛、胸痛、心悸、心动过速、肌痛、支气管炎、咳嗽、瘙痒、尿失禁、膀胱炎及鼻炎、阴茎异常勃起、阳痿、皮疹、血小板减少症、紫癜、鼻出血、白细胞减少、血尿、胆汁淤积、黄疸、肝功能异常及视物模糊。

【用法与用量】口服：①成年人推荐剂量为控释片一日 4 mg，睡前服用。不得咀嚼、掰开或碾碎后服用。②肾功能不全患者和老年患者应用常规量，无需调整。

【制剂与规格】甲磺酸多沙唑嗪控释片：4 mg。

阿夫唑嗪[保(乙)]

Alfuzosin

【适应证】用于缓解良性前列腺增生的症状与体征。

【注意事项】(1) 严重肾功能不全者，患者驾驶、机械操作或有危险的工作时应慎用。(2) 老年人慎用，一日剂量不超过 10 mg。65 岁以上或正在接受治疗的高血压病人，起始剂量应为 2.5 mg，一日 2

次；并避免与钙通道阻滞药合用，以防导致严重低血压。对正在服用抗高血压药的高龄患者伴有肾功能不全，在服药后症状得不到预期效果，不应继续增量，而应改用其他适当的治疗方法。(3) 冠心病患者在心绞痛发作期间和恶化时应停用。(4) 患者需要麻醉时，应在麻醉前停用。(5) 与抗高血压药合并使用要注意血压的变化。(6) 有患者站立时服药出现动脉血压降低的现象，常伴有眩晕、疲乏、出汗的症状，在此情况下，患者应躺下。

【禁忌证】对本品过敏者、严重肝功能不全、肾衰竭者（肌酐清除率＜每分钟 30 ml）、低血压、直立性低血压、肠梗阻者（片剂中含蓖麻油）、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见胃肠道紊乱、恶心、胃痛、腹泻、眩晕、头晕、不适、头痛。罕见有直立性低血压、晕厥、心动过速、心悸、胸痛、乏力、瞌睡、水肿、皮肤潮红、口干、皮疹、瘙痒。

【用法与用量】口服：用于良性前列腺增生，普通片一次 2.5 mg，一日 3 次，最大剂量一日 10 mg；老年患者（年龄＞65 岁），初始剂量一次 2.5 mg，一日 2 次；缓释片一次 10 mg，一日 1 次，晚餐后立即服用，整片吞服，不能掰开或咀嚼。

【制剂与规格】盐酸阿夫唑嗪糖衣片：2.5 mg。

盐酸阿夫唑嗪缓释片：① 5 mg；② 10 mg。

特拉唑嗪 [基(基)，保(甲)]

Terazosin

【适应证】(1) 轻度或中度高血压治疗。可与噻嗪类利尿药或其他抗高血压药物合用，也可单独使用。(2) 治疗良性前列腺增生引起的症状如尿频、尿急、尿线变细、排尿困难、夜尿增多及排尿不尽感。

【注意事项】(1) 肾功能损伤患者无需改变剂量。(2) 哺乳期妇女使用本品时应停止授乳。(3) 老年患者较年轻患者更易发生直立性低血压。(4) 加用噻嗪类利尿药或其他抗高血压药时应减少本药用量。(5) 建议特拉唑嗪不用于有排尿晕厥史的患者。建议给予初始剂量 12 小时内或剂量增加时应避免从事驾驶或危险工作。(6) 首次用药、剂量增加时或停药后重新用药会发生眩晕、轻度头痛或瞌睡，一般连续用药阶段不会再发生该反应。如果发生眩晕，应当将患者放置平卧姿势。(7) 使用本品治疗良性前列腺增生前应排除前列腺癌的可能性。

【禁忌证】已知对本品及 α 受体拮抗药过敏者、孕妇。

【不良反应】常见体虚、疲乏、心悸、恶心、外周水肿、眩晕、嗜睡、鼻充血／鼻炎和视物模糊／弱视。其他可见背痛、头痛、心动过速、直立性低血压、晕厥、水肿、体重增加、肢端疼痛、性欲降低、抑郁、神经质、感觉异常、呼吸困难、鼻窦炎、阳痿。偶见过敏反应、血小板减少症和阴茎异常勃起等。

【用法与用量】口服：①高血压，初始剂量为睡前服用 1 mg，且不应超过，以尽量减少首剂低血压事件的发生。1 周后一日单剂量可加倍以达到预期效应。常用维持剂量为一日 2 ～ 10 mg。②良性前列腺增生初始剂量为睡前服用 1mg，且不可超过。1 周或 2 周后一日单剂量可加倍以达到预期效应。常用维持剂量为一次 2 ～ 4 mg，一日 1 次，最大剂量不超过 10 mg。(3) 老年人不必改变剂量。(4) 肾功能损伤患者不必改变剂量。

【制剂与规格】盐酸特拉唑嗪片：2 mg。

坦洛新（坦索罗辛）[保(乙)]

Tamsulosin

【适应证】用于前列腺增生引起的排尿障碍。

【注意事项】(1) 肾功能不全患者慎用。(2) 直立性低血压患者慎用。与降压药合并使用要注意血压的变化。(3) 高龄患者应注意用药后状况，如得不到期待的效果不应继续增量，应改用其他方法治疗。(4) 排除前列腺癌诊断之后可使用本品。

【禁忌证】对本品或 α 受体拮抗药过敏者，儿童禁用。

【不良反应】(1) 精神神经系统：偶见头晕、蹒跚感等。(2) 循环系统：偶见血压下降、心率加快等。(3) 消化系统：偶见恶心、呕吐、胃部不适、腹痛、食欲

缺乏等。(4) 过敏反应：偶尔可出现皮疹。(5) 偶见肝功能异常、鼻塞、水肿、吞咽困难、倦怠感等。

【用法与用量】口服：成人常用量一次 0.2 mg，一日 1 次，餐后服用。可根据年龄、症状适当增减。注意不要嚼碎胶囊内的颗粒。

【制剂与规格】盐酸坦洛新（坦索罗辛）缓释胶囊：0.2 mg。

8.11.2 5α－还原酶抑制药

5α－还原酶抑制药治疗良性前列腺增生是基于通过抑制 5α－还原酶进而抑制双氢睾酮（DHT）的产生，引起前列腺上皮细胞的萎缩，达到缩小前列腺体积、缓解 BPH 临床症状的目的。

非那雄胺[保(乙)]

Finasteride

【适应证】(1) 用于治疗和控制良性前列腺增生以及预防泌尿系统事件，可降低发生急性尿潴留的危险性及需经尿道切除前列腺和前列腺切除术的危险性。(2) 本品可使肥大的前列腺缩小，改善尿流及改善前列腺增生有关的症状，前列腺肥大患者适用。

【注意事项】(1) 孕妇不能触摸本品的碎片和裂片，否则，对男性胎儿有影响。(2) 对于大量残留尿和严重尿流减少的患者，应密切监测其阻塞性尿道病；(3) 使用本品应定期行直肠指诊做前列腺检查，本品可使前列腺特异抗原水平降低，因此服用本品后前列腺特异抗原降低并不排除同时存在前列腺癌。(4) 当患者的性伴侣妊娠或可能妊娠时，应避免其伴侣接触其精液或停止服用本品。

【禁忌证】妇女、儿童、对本品任何成分过敏者。

【不良反应】可见性欲减退、阳痿、射精量减少、乳房不适（乳腺增生及乳房触痛）、过敏反应（瘙痒、风疹、面唇部肿胀等）、睾丸疼痛等。

【用法与用量】口服：①成人一日 5 mg。② 70 岁以上老年患者对本品清除率有所降低，但不需调整剂量。③肾功能不全者剂量不需要调整。

【制剂与规格】非那雄胺片：5 mg。

依立雄胺（爱普列特）

Epristeride

【适应证】用于治疗良性前列腺增生，改善良性前列腺增生的有关症状。

【注意事项】(1) 服用本品者在使用血清 PSA 指标检测前列腺癌时，应提请医生充分考虑患者因服用本品而致血清 PSA 下降的重要因素。(2) 治疗前需明确诊断，注意排除感染、前列腺癌、低张力膀胱及其他尿道梗阻性疾病等。

【禁忌证】对本品组分过敏者。

【不良反应】可见恶心、食欲缺乏、腹胀、腹泻、口干、头晕、失眠、全身乏力、皮疹、性欲减退、勃起功能障碍、射精量下降、耳鸣、耳塞、髋部痛等，其发生率约为 6.63%。实验室检查异常发生率为 2.49%，包括肝功能异常（ALT 及 AST 升高、总胆红素升高）、肾功能异常（尿素氮升高、肌酐升高）、血常规异常（血红蛋白降低、白细胞降低、血小板降低）。

【用法与用量】口服：一次 5 mg，一日 2 次，餐前或餐后均可，疗程 4 个月或遵照医嘱。

【制剂与规格】依立雄胺片：5 mg。

8.11.3 植物制剂

植物制剂在缓解良性前列腺增生相关下尿路症状方面获得了一定的临床疗效，但植物制剂的具体生物学作用机制有待进一步研究。

普适泰[保(乙)]

Prostat

【适应证】用于良性前列腺增生，慢性非细菌性前列腺炎。

【注意事项】(1) 前列腺感染、尿道狭窄、前列腺结石、膀胱颈硬化、前列腺癌和其他前列腺疾病都会引起类似症状，所以在使用本品治疗前应对上述症状做出正确判断。(2) 由于本品起效慢，3～6 个月才收到明显效果，故对残余尿量大或尿速严重降低者宜慎用，且需密切观察，以防尿路梗阻。(3) 临服前才将铝箔撕开，以免药片吸潮变质。

【禁忌证】对本品过敏者、儿童。

【不良反应】极少数人有轻微的腹胀、胃灼热、恶心，停药后症状消失。

【用法与用量】口服：一次 1 片，一日 2 次，于早晚服用，疗程 3 ~ 6 个月，如有必要可继续使用。可在进食时或单独服用。高龄或肾功能不全者无需调整剂量。

【制剂与规格】普适泰片：74 mg（每片含花粉提取物 P_5 70 mg 及花粉提取物 EA-10 4 mg）。

8.12 前列腺炎及其药物治疗

8.12.1 前列腺炎

前列腺炎（prostatitis）是由于前列腺受到微生物等病原体感染或某些非感染因素刺激而发生的炎症反应，及由此造成的前列腺区域不适或疼痛、排尿异常等临床表现。

前列腺炎可分为以下 4 类：Ⅰ型，急性细菌性前列腺炎；Ⅱ型，慢性细菌性前列腺炎；Ⅲ型，慢性非细菌性前列腺炎（CP）/慢性骨盆疼痛综合征（CPPS），CPPS 又可进一步分为Ⅲ A 型和Ⅲ B 型（Ⅲ A 型为炎症性慢性骨盆疼痛综合征，Ⅲ B 型为非炎症性慢性盆腔疼痛综合征）；Ⅳ型，无症状的前列腺炎。

8.12.2 药物治疗

药物是治疗前列腺炎的主要手段，可以辅助以物理、心理治疗。选择治疗方法时多倾向根据病情及个体化原则进行综合治疗，尽量避免有创伤的方法，治疗过程需定期随诊并调整治疗方案。

（1）Ⅰ型：首先选择静脉应用广谱抗生素，如第三代头孢菌素，待尿培养结果报告后，选用敏感抗生素。待患者症状改善后，可改为口服广谱抗生素（氟喹诺酮类），疗程至少 4 周。

（2）Ⅱ型：根据细菌培养结果和药物穿透前列腺的能力选择抗生素，常用氟喹诺酮类药物（如环丙沙星、左氧氟沙星和洛美沙星等）、四环素类（如米诺环素等）和磺胺类（如复方磺胺甲噁唑）（任选一种）。疗程为 4 ~ 6 周，其间应对患者进行阶段性的疗效评价。

（3）Ⅲ A 型：推荐口服喹诺酮类抗生素 2 ~ 4 周。推荐联合使用 α 受体拮抗药改善排尿症状和疼痛，在停用抗生素后应继续使用 α 受体拮抗药至 12 周以上。常用 α 受体拮抗药有阿夫唑嗪、多沙唑嗪、坦洛新和特拉唑嗪（任选一种）。

（4）Ⅲ B 型：推荐使用 α 受体拮抗药，疗程持续 12 周以上，也可选择非甾体抗炎镇痛药、植物制剂和 M 受体拮抗药等治疗。

（5）Ⅳ型：一般不需治疗。

8.13 勃起功能障碍及其药物治疗

8.13.1 勃起功能障碍

勃起功能障碍（erectile dysfunction，ED）是指性生活时阴茎勃起硬度不足于插入阴道内，或阴茎勃起维持时间不足于完成满意的性生活。

勃起功能障碍可以分为心理性 ED、神经性 ED、血管性 ED、低雄激素性 ED、药物性 ED 以及系统性疾病所致的 ED。

8.13.2 药物治疗

（1）勃起功能障碍的治疗首先选择口服药物选择性磷酸二酯酶 -5 型（PDE5）抑制药，包括西地那非、伐地那非和他达拉非。以上 3 种药物作为性生活需要时服用的一次性治疗药物，均可在性生活前 1 小时左右服用，服用后需要足够的性刺激才起效。上述 3 种药物在治疗勃起功能障碍时作用机制相同，疗效 80% 左右，轻度一过性不良反应发生率 15% 左右，大量临床使用证明，治疗各种原因引起的 ED 安全、有效。上述 3 种药物还具有轻度降低血压的作用，如果硝酸酯类药物同时服用可能显著降低血压引起心血管危险。因此，均禁忌配伍使用，服用 α_1 受体拮抗药的患者限制配伍使用上述药物。药物的半衰期分别为他达拉非 17.5 小时，西地那非、伐地那非为 4 小时，患者可根据需要选择药物。

（2）研究表明，睾丸功能障碍引起雄激素水平降低的 ED 患者可用雄激素制剂（十一酸睾酮胶囊或胶丸）补充治疗。

(3) 如果口服选择性 PDE5 抑制药无效的患者，可以选择罂粟碱、酚妥拉明和前列地尔等（任选一种）阴茎海绵体内药物注射治疗。但是，阴茎海绵体内药物注射疗法必须在医生指导下，明确筛选个体化药物剂量，熟练药物注射方法，熟悉可能发生的并发症，如药物使用过量引起阴茎异常勃起的严重并发症应采取紧急治疗措施。

(4) 阴茎海绵体内注射疗法使用药物：目前，口服 PDE5 抑制药治疗无效的患者，可试用阴茎海绵体药物注射疗法。阴茎海绵体内药物注射疗法须取得患者知情同意书，在医生指导下使用，首先调整最佳安全、有效治疗剂量，从小剂量开始逐渐加大剂量直到诱发满意的勃起为止。在患者自己注射过程中，每天必须按预定的剂量只注射 1 次，以防异常勃起发生。一旦发生 4 小时以上的持续勃起可诊断为异常勃起，立即到医院进行紧急处理。①单药治疗：罂粟碱，一次 5 ~ 60 mg；酚妥拉明，一次 0.25 ~ 1.0 mg；前列地尔，一次 10 ~ 20 μg。②联合治疗：罂粟碱／酚妥拉明二联疗法（罂粟碱 30 mg、酚妥拉明 1 mg），即上述剂量混合的药液一次抽取 0.5 ~ 1.0 ml 注射。罂粟碱／酚妥拉明／前列地尔三联疗法（罂粟碱 30 mg、酚妥拉明 1 mg、前列地尔 20 μg），即上述 3 药剂量混合的药液一次抽取 0.5 ~ 1.0 ml 注射。

对于上述药物治疗无效的严重器质性勃起功能障碍患者通常需要进行阴茎起勃器植入手术治疗。

西地那非

Sildenafil

【适应证】用于勃起功能障碍。

【注意事项】(1) 肝功能不全：肝硬化（Child-Pugh 分级 A 级和 B 级）志愿受试者的西地那非清除率降低，与同年龄组无肝损害的志愿者相比，AUC 和 C_{max} 分别增高 84% 和 47%。故肝受损患者应减少剂量。(2) 轻度和中度肾损害患者药动学没有改变，不需调整剂量。重度肾损害患者本品清除率降低，与同年龄组健康志愿者相比，AUC 和 C_{max} 几乎加倍。故应减少剂量。(3) 本品不适用于妇女和儿童。(4) 慎用于有心血管疾病的患者，对于存在阴茎解剖性畸形（如阴茎成角、海绵体纤维化或 Peyronie's 病等）和阴茎异常勃起倾向（如镰状细胞贫血、多发性骨髓瘤或白血病等）的患者也应慎用。(5) 健康老年志愿者（≥ 65 岁）的西地那非清除率降低，游离血药浓度比青年健康志愿者（18 ~ 45 岁）约高 40%。故 65 岁以上老年患者应减少剂量。(6) 当发生药物过量时，应根据需要采取常规支持疗法。因西地那非与血浆蛋白结合率高，故肾脏透析不会增加清除率。(7) 在已有心血管危险因素存在时，用药后性活动有发生非致命性／致命性心脏事件的危险。在性活动开始时如出现心绞痛、头晕、恶心等症状，须终止性活动。(8) 本品上市后，有少量勃起时间延长（超过 4 小时）和异常勃起（痛性勃起超过 6 小时）的报道。如持续勃起超过 4 小时，患者应立即就诊。如异常勃起未得到即时处理，阴茎组织可能受到损害并可能导致永久性勃起功能丧失。

【禁忌证】服用硝酸酯类药者、对西地那非中任何成分过敏者。

【不良反应】常见头痛、面部潮红、消化不良、鼻塞及视觉异常等。视觉异常为轻度和一过性的，主要表现为视物色淡、光感增强或视物模糊。较严重的不良反应为心脑血管反应：如心肌梗死、心源性猝死、心律失常、脑出血等；泌尿系统可见勃起时间长、异常勃起和血尿；神经系统可见癫痫发作和焦虑；眼部可见视网膜血管病变或出血、玻璃体剥离、黄斑周围水肿等。

【用法与用量】口服：(1) 18 岁以上成人首次剂量 50 mg，在性生活前 1 小时左右服用，根据药效反应，可以对单次剂量进行调整，一般剂量范围为 25 ~ 100 mg。24 小时内最多服用 1 次，单次最大剂量 100 mg。(2) 年龄 65 岁以上、肝脏受损、重度肾损害患者的起始剂量以 25 mg 为宜。

【制剂与规格】枸橼酸西地那非片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

伐地那非

Vardenafil

【适应证】用于勃起功能障碍。

【注意事项】(1) 轻度肝损害的患者（Child-Pugh A级）不需调整剂量；中度肝损害患者（Child-Pugh B级），由于伐地那非的清除率减少，建议起始剂量为5 mg，随后根据耐受性和药效逐渐增加到10 mg；重度肝损害患者（Child-Pugh C级）的伐地那非的药动学研究尚未进行。(2) 轻度、中度或重度肾损害的患者均无需进行剂量调整。(3) 下列情况慎用：低血压（静息收缩压 < 90 mmHg），近期患有脑卒中或心肌梗死（6个月内），不稳定型心绞痛，家族退行性眼部疾病如色素性视网膜炎。对于阴茎具有解剖畸形的（如阴茎成角、海绵体纤维化、Peyronie病）或者阴茎勃起无法消退（如镰状细胞病、多发性骨髓瘤和白血病）的患者，治疗其勃起障碍时需慎用。(4) 老年患者（≥65岁）伐地那非清除率减少，应减少服用剂量。(5) 由于性活动伴有一定程度的心脏危险性，故医生对患者勃起障碍采取任何治疗之前，应首先考虑其心脏状况。(6) 治疗剂量（10 mg）和超剂量（80 mg）的伐地那非导致QT间期的延长。临床应用伐地那非时须考虑到这点。先天性QT间期延长（长QT综合征）的患者和服用IA类（如奎尼丁，普鲁卡因胺）或Ⅲ类（如胺碘酮，索他洛尔）抗心律失常药物应避免服用伐地那非。(7) 同时服用伐地那非和α受体拮抗药可能导致症状性低血压。除非有进一步的资料，服用α受体拮抗药6小时内不能服用伐地那非。服药6小时后，应用伐地那非的最大剂量不得超过5 mg。但患者服用α受体拮抗药坦洛新时，对服药间歇不作要求。(8) 驾驶和操作机械之前患者应考虑到自身对伐地那非的反应。

【禁忌证】(1) 对药物的任何成分（活性成分或非活性成分）有过敏症状的患者禁用。(2) 服用硝酸盐类或一氧化氮供体治疗的患者禁用。(3) 避免HIV蛋白激酶抑制药茚地那韦或利托那韦与伐地那非同时使用，两者都是强效CYP3A4抑制药。

【不良反应】通常是一过性、轻度到中度的。发生率≥10%的不良反应有头痛、面色潮红；≥1%的有消化不良、恶心、眩晕、鼻炎；≥0.1%的有面部水肿、光过敏反应、背痛、肝功能异常、GGTP升高、肌酸激酶升高、肌痛、嗜睡、呼吸困难、视觉异常、多泪、阴茎异常勃起症（包括勃起延长或疼痛）；≤0.1%的有过敏反应（包括喉部水肿）、心绞痛、低血压、心肌缺血、直立性低血压、晕厥、神经紧张、鼻出血、青光眼。

【用法与用量】口服：(1) 18岁以上成人首次剂量10 mg，在性生活前25～60分钟(或更长达4～5小时仍奏效)服用，根据药效反应，可以对单次剂量进行调整，可以增加到20 mg或减少到5 mg，24小时内最多服用1次。最大推荐剂量为一日20 mg。(2) 老年患者（≥65岁）伐地那非的清除率减少，起始剂量考虑为5 mg。(3) 正在服用α受体拮抗药的患者首剂为5 mg。(4) 肝损害患者：轻度肝损害的患者不需调整剂量；中度肝损害患者建议起始剂量为5 mg，随后根据耐受性和药效逐渐增加到10 mg。

【制剂与规格】盐酸伐地那非片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

他达拉非

Tadalafil

【适应证】用于勃起功能障碍。

【注意事项】(1) 重度肝功能不全患者使用本品的临床安全性信息有限，应用本品应权衡利弊。(2) 本品不用于妇女。未在妊娠妇女中进行他达拉非的研究。大鼠和小鼠给予高达一日1 000 mg/kg的剂量，未见胚胎致畸、胚胎毒性和胎儿毒性。(3) 下列情况慎用：容易发生异常勃起的患者（如镰状细胞贫血、多发性骨髓瘤或白血病），阴茎解剖异常的患者（如阴茎成角、畸形阴茎、海绵体纤维化或Peyronie's病）、患有心血管病因素或有心血管疾病者。(4) 18岁以下者不得服用本品。(5) 老年人：健康老年受试者（65岁或以上）口服他达拉非清除率较低，使得AUC比19～45岁的健康受试者高25%。这一年龄的影响无临床意义，且无需调整剂量。(6) 正在使用α_1受体拮抗

药(如多沙唑嗪)的患者,如联合使用本品,可能导致症状性低血压。(7) 正在使用强效 CYP3A4 抑制药(如利托那韦、沙奎那韦、酮康唑、伊曲康唑、红霉素)的患者,应慎用。

【禁忌证】(1) 正在服用任何形式硝酸盐类药物的患者禁止服用本品。(2) 性生活会给心脏病患者带来潜在的心脏风险。因此,勃起功能障碍的治疗药物,包括本品在内,不应用于不宜进行性生活的心脏病患者。如:①在最近 90 日内发生过心肌梗死的患者;②不稳定型心绞痛或在性交过程中发生过心绞痛的患者;③在过去 6 个月内达到纽约心脏病协会诊断标准 2 级或超过 2 级的心力衰竭患者;④难治性心律失常、低血压(<90/50 mmHg),或难治性高血压患者;⑤最近 6 个月内发生过卒中的患者。(3) 已知对本品过敏的患者。(4) 具有半乳糖不耐受的遗传性问题的患者、半乳糖分解酶缺乏的患者或者葡萄糖-半乳糖吸收不良的患者。

【不良反应】常见头痛、消化不良、头晕、眼花、面部潮红、鼻腔充血、背痛、肌痛等。少见眼睑肿胀、眼痛和结膜充血。本品不良反应短暂而轻微的。

【用法与用量】口服:(1) 成年人推荐剂量为 10 mg,在进行性生活之前服用,不受进食的影响。如果效果不显著,可以服用 20 mg。可至少在性生活前 30 分钟服用。最大服药频率为一日 1 次。最好不要连续一日服用他达拉非,因为尚未确定长期服用的安全性。(2) 老年人无需调整剂量。(3) 重度肾功能不全的患者,最大推荐剂量为 10 mg。(4) 肝功能不全患者推荐剂量为 10 mg。

【制剂与规格】他达拉非片:20mg。

十一酸睾酮[保(乙)]

Testosterone Undecanoate

【适应证】(1) 原发性或继发性性腺功能减退。(2) 男孩性青春期延迟。(3) 乳腺癌转移的姑息性治疗。(4) 再生障碍性贫血的辅助治疗。(5) 中老年部分性雄激素缺乏综合征。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全患者慎用。(2) 下列情况慎用:心脏病、前列腺肥大、高血压、癫痫及三叉神经痛者慎用。(3) 长期应用可致儿童早熟、骨骼早闭,影响生长发育,应慎用。(4) 老年患者代谢功能低下,前列腺易增生,应慎用。(5) 前列腺增生患者慎用,使用期间定期检查。(6) 本品所含有的成分有可能使兴奋剂测试呈阳性。

【禁忌证】孕妇及哺乳妇女、前列腺癌患者。

【不良反应】常见多毛、痤疮、阴茎异常勃起及其他性刺激过度症状、精子减少、精液量减少和水盐潴留。偶见胃肠不适或过敏反应。在青春期前男孩中可有性早熟、阴茎勃起增加、阴茎增大、骺骨早闭。

【用法与用量】(1) 口服:必须在专科医生指导下使用。开始剂量按一日 120 ~ 160 mg,用药 2 周后,以一日 40 ~ 120 mg 的剂量维持。早、晚于餐后服用,若每日服用的胶囊成单数,可在早上多服 1 粒,或遵医嘱。(2) 肌内注射:一次 250 mg,1 个月 1 次。

【制剂与规格】十一酸睾酮胶囊或胶丸:40 mg。

十一酸睾酮注射液:2 ml : 0.25 g。

苯丙酸诺龙[保(甲)]

Nandrolone Phenylpropionate

【适应证】(1) 女性晚期乳腺癌姑息性治疗。(2) 伴有蛋白分解的消耗性疾病的治疗。

【注意事项】心、肝、肾疾病患者,肿瘤骨转移者,糖尿病,前列腺增生患者慎用。

【禁忌证】高血压、孕妇及前列腺癌患者禁用。

【不良反应】(1) 本品有轻微男性化作用,妇女使用后,可能会长胡须,粉刺增多,多毛症,声音变粗,阴蒂肥大、闭经或月经紊乱等反应。(2) 男性长期使用可能会有痤疮、精子减少、精液减少。(3) 肝脏:ALT、AST 上升,黄疸。(4) 消化系统:恶心、呕吐、消化不良、腹泻。(5) 电解质:水钠潴留。(6) 皮肤:皮疹、颜面潮红。

【用法与用量】深部肌内注射:成人常用量:①女性转移性乳腺癌姑息性治疗:

一周 25 ~ 100 mg。一般须持续至 12 周，如有必要，治疗结束 4 周后，可进行第 2 个疗程；②蛋白大量分解的严重消耗性疾病，如严重烧伤、慢性腹泻、大手术后等。一周 25 ~ 50 mg，同时须摄入充足的热量和蛋白质。

【制剂与规格】苯丙酸诺龙注射液：① 1 ml ：10 mg；② 1 ml ：25 mg；③ 1 ml ：50 mg。

司坦唑醇[保(乙)]

Stanozolol

【适应证】(1) 遗传性血管神经性水肿的预防和治疗；(2) 严重创伤、慢性感染、营养不良等消耗性疾病。

【注意事项】卟啉症患者、前列腺肥大、糖尿病患者慎用。儿童慎用，易早熟、影响生长。易引起水钠潴留，高钾血症应慎用。

【禁忌证】严重肝病、肾脏病、心脏病、高血压患者、孕妇及前列腺癌患者禁用。

【不良反应】(1) 女性：长期使用可能会有痤疮、多毛、阴蒂肥大、闭经或月经紊乱等症。(2) 男性：长期使用可能会有痤疮、精子减少、精液减少。(3) 肝脏：ALT、AST 升高、黄疸。(4) 消化系统：恶心、呕吐、消化不良、腹泻。(5) 电解质：水钠潴留、水肿。(6) 皮肤：皮疹、颜面潮红。

【用法与用量】(1) 成人和青少年：①预防和治疗遗传性血管神经性水肿：口服，开始一次 2 mg，一日 3 次，女性可一次 2 mg。如治疗效果明显，可每间隔 1 ~ 3 个月减量，直至一日 2 mg 维持量。但减量过程中，须密切观察病情。②用于慢性消耗性疾病、手术后体弱、创伤经久不愈等治疗：口服，一日 3 次，一次 2 ~ 4 mg，女性酌减。(2) 儿童：用于遗传性血管神经性水肿。6 岁以下，一日口服 1 mg，仅在发作时应用；6 ~ 12 岁，一日口服 2 mg，仅在发作时应用。

【制剂与规格】司坦唑醇片：2 mg。

前列地尔[保(乙)]

Alprostadil

【适应证】(1) 心肌梗死、血栓性脉管炎、闭塞性动脉硬化等症。(2) 治疗慢性动脉闭塞症如血栓闭塞性脉管炎、慢性动脉粥样硬化所致的肢体慢性溃疡，微血管循环障碍所致的四肢静息性疼痛。(3) 可作为血管移植术后的抗栓治疗，用以抑制移植血管内的血栓形成（本品能用于小儿先天性动脉导管未闭症的手术前治疗，用以缓解低氧血症保持导管血流以等候时机手术治疗）。(4) 勃起功能障碍疾病的诊断和治疗。

【注意事项】(1) 下列情况慎用：心功能不全、青光眼或眼压增高、活动性胃溃疡、间质性肺炎患者。(2) 本品仅是对症治疗，缓解慢性动脉闭塞症或脉管炎的临床症状，如静息性肢痛或慢性下肢溃疡的促进愈合。停药后有复发的可能。(3) 本品在阴茎海绵体注射后出现异常勃起应及时就医。(4) 给药时注意：①出现不良反应时，应采取变更给药速度、停止给药等措施；②本制剂不能与输液以外的药品混合使用，避免与血浆增容剂（右旋糖酐、明胶制剂等）混合；③本制剂与输液混合后在 2 小时内使用。剩余液体不能再使用；④不能使用冻结的药品。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者、严重心力衰竭或心功能不全患者、妊娠或可能妊娠的妇女。(2) 因患镰状细胞贫血、多发性骨髓瘤、白血病而易诱发阴茎异常勃起的患者。(3) 阴茎解剖学畸形（阴茎成角、海绵体纤维化、Peyronie 病的患者）；(4) 阴茎植入假体者。

【不良反应】(1) 偶见休克，要注意观察，发现异常现象时应即停药，采取适当的措施。注射部位有时出现血管炎、血管疼痛、红肿、发硬、瘙痒等。(2) 循环系统：有时出现心力衰竭加重、肺水肿、胸闷、血压下降等，一旦出现立即停药；偶见面部潮红、心悸。(3) 消化系统：可见腹泻、腹胀、胃肠不适；偶见腹痛、食欲缺乏、呕吐、便秘、ALT 及 AST 升高等。(4) 精神和神经系统：可见头晕、头痛、发热、疲劳感，偶见发麻。(5) 皮肤：偶见皮疹、荨麻疹、瘙痒。(6) 血液系统：偶见嗜酸性细胞增多、白细胞减少。(7) 其他：偶见视力下降、口腔肿胀感、脱发、四肢疼痛、水肿、发热及不适感。

【用法与用量】下列用法和剂量都为成人常用量。(1) 静脉滴注：将本品溶于250 ml或500 ml 0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液中。①心肌梗死，一日剂量100～200μg，重症可适当增加，但不得超过400μg。②用于血栓性脉管炎、闭塞性动脉硬化，一日剂量100～200μg。③视网膜中央静脉血栓，一日100～200μg。(2) 阴茎海绵体内局部注射治疗勃起功能障碍：在海绵体内直接注射，一般剂量一次10～20μg，一日1次或一周3次。具体给药方法：首次剂量2.5μg，间隔5～10秒，如有轻微反应，再次剂量可增至5μg；然后根据勃起反应，可再增加剂量5～10μg，以达到充分勃起而且勃起持续时间不超过1小时为最佳剂量。对于神经性勃起功能障碍，首次剂量1.25μg，再次剂量2.5μg，第三次剂量5μg，然后每次增加5μg直至达到满意勃起则为最合适剂量。在专业医师指导下，按每个患者的阴茎勃起程度确定剂量，直到该剂量使阴茎勃起能完成性交且勃起时间不超过1小时。维持治疗时，调整剂量需按照初始剂量时的标准，注射频度不超过一日1次及一周3次。

【制剂与规格】注射用前列地尔：① 10μg；② 20μg；③ 100μg。

前列地尔注射液：① 2 ml : 10μg；② 2 ml : 20μg。

萘哌地尔[保(乙)]

Naftopidil

【适应证】(1) 用于缓解良性前列腺增生症（BPH）引起的尿路梗阻症状。(2) 用于高血压病的降压治疗。

【注意事项】(1) 下列情况慎用：重症心脑血管疾病患者初次使用时及肝功能损伤者。血压偏低者或同时使用降压药的患者。妊娠期及哺乳期妇女、儿童及老年患者。(2) 本品在用药初期及用量剧增时能引起直立性低血压，导致头晕、起立性眩晕，故高空作业及机动车驾驶员等从事具有危险性职业者应慎用。(3) 服用期间，应注意血压变化，发现血压降低时应酌情减量或停止使用。

【禁忌证】对本品有过敏史者禁用。

【不良反应】偶见头晕、直立性眩晕、头重、头疼、耳鸣、便秘、胃部不适、水肿、寒战、AST及ALT升高。

【用法与用量】(1) 用于良性前列腺增生症（BPH）引起的尿路梗阻症的治疗：口服。成人初始用量为一次25 mg，一日1次，于睡前服用，剂量可随临床疗效做适当调整。一日最大剂量不得超过75 mg，高龄患者应从低剂量（一日12.5 mg）开始用药，同时注意监护。(2) 用于高血压病的降压治疗：本品应根据病情和医师的临床诊断实行个体化用药。常用的起始剂量为一次25 mg，一日2次。两周后，可根据患者血压的下降程度调整剂量。推荐剂量范围为一次25～50 mg，一日2次。

【制剂与规格】萘哌地尔片：① 12.5 mg；② 25 mg。

萘哌地尔胶囊：25 mg。

萘哌地尔分散片：25 mg。

8.14 阴茎异常勃起及其药物治疗

阴茎异常勃起是指阴茎持续性勃起4小时以上并伴有疼痛，且性高潮后不能转入疲软状态。阴茎异常勃起包括高流量(非缺血性）和低流量（缺血性）两类，其中缺血性阴茎异常勃起较为常见，常可因组织细胞低氧血症引起严重的阴茎海绵体组织损伤。

缺血性阴茎异常勃起是男科急症之一，缺血性阴茎异常勃起持续12小时可引起局部组织酸中毒（pH<7.25），24小时可引起海绵体组织变性坏死，继发海绵体组织纤维化，如果不及时治疗可永久性丧失勃起功能。

缺血性阴茎异常勃起，需要尽快诊断及时治疗。一旦明确诊断可采用一般支持疗法，给予吸氧，输液、碱性药物的基础上，首选肾上腺素制剂阴茎海绵体注射诱导平滑肌收缩而诱导阴茎疲软。推荐α受体激动剂去氧肾上腺素作为首选药。缺血性阴茎异常勃起早期（24小时以内），去氧肾上腺素10 mg加0.9%氯化钠注射液10 ml稀释后，取稀释液3～5 ml注入阴茎海绵体，在5～10分钟后可重复，但

总量不宜超过 100 ~ 200 mg。使用去氧肾上腺素时必须取得患者知情同意书，注意观察患者全身状况，严密监测血压和心电图，必要时需要配伍使用有效降压药物。

除去氧肾上腺素外，其他肾上腺素激动药的用法为阴茎海绵体注射，去甲肾上腺素一次 0.2 ~ 0.5 mg，肾上腺素一次 0.05 ~ 0.1 mg，麻黄碱一次 50 ~ 100 mg。对于上述药物治疗无效者，可行手术治疗。

8.15 泌尿和男性生殖系统肿瘤及其药物治疗

相关内容见第 10 章肿瘤用药。

8.15.1 肾细胞癌及其药物治疗

肾细胞癌（renal cell carcinoma）仅占全身恶性肿瘤的 2% ~ 3%，却是泌尿、男性生殖系统中排序第二的常见恶性病变，根治性肾切除术仍是治愈肾细胞癌的唯一方法，但保留肾单位的肿瘤肾部分切除术的开展有越来越广泛的趋势。另外，随着技术的进步，有越来越多的上述手术是在腹腔镜下完成的。

(1) 复发和转移性肾细胞癌的治疗比较困难，传统的放疗和化疗均不敏感。白细胞介素 -2(IL-2)或干扰素 -α (IFN-α) 为转移性肾细胞癌（临床分期 IV 期）治疗的一线治疗方案，单药治疗的有效率为 10% ~ 20%。①白细胞介素 -2（IL-2）大剂量治疗方案：白细胞介素 -2 60 万 ~ 72 万 U/kg，静脉注射 15 分钟，每间隔 8 小时给药 1 次，第 1 ~ 5 日，第 15 ~ 19 日。间隔 9 日后重复 1 次。②干扰素(IFN-α) 治疗方案：干扰素（IFN-α）：一次 900 万 U，肌内注射或皮下注射，每周 3 次。共 12 周。与单药治疗相比，IL-2 联合 IFN-α 治疗只是增加不良反应的发生率，并未能提高患者的生存率。

(2) 肾细胞癌对大多数化疗药普遍耐药，最近研究表明，单独使用吉西他滨 - 卡培他滨为治疗转移性肾细胞癌的常用化疗方案。①吉西他滨：成人单独推荐剂量为 1 000 mg/m^2，静脉注射，第 1、8、15 日，随后间歇 1 周，每 4 周重复 1 次。可依据患者的毒性反应相应减少剂量。②吉西他滨 - 卡培他滨方案：吉西他滨 1 000 mg/m^2，静脉注射，第 1，8，15 日；卡培他滨 830 mg/m^2，口服，一日 2 次，连续 21 日每 4 周重复 1 次。

(3) 近年来，针对肿瘤血管生成及肿瘤细胞生长信号通路上某些位点的靶向治疗药在晚期肾细胞癌的治疗方面获得进展，有望成为今后晚期肾细胞癌治疗的首选。国内已获准临床应用的有索拉非尼和舒尼替尼。

①索拉非尼：适用于治疗晚期肾细胞癌，口服，推荐剂量为一次 400 mg，一日 2 次，不可与食物同服（宜在进食前 1 小时或进食后 2 小时服药）。若患者出现不良反应，给药剂量可降至 400 mg，一日 1 次或隔日 1 次。

②舒尼替尼：该药是一种能够选择性地抑制多种受体酪氨酸激酶的新型靶向药品。抑制受体酪氨酸激酶被认为可经阻断肿瘤生长所需的血液和营养物质供给而“饿死”肿瘤并具有同时杀死肿瘤细胞的活性，即舒尼替尼结合了终止向肿瘤细胞供应血液的抗血管形成和直接攻击肿瘤细胞的抗肿瘤这两种机制。它既能直接攻击肿瘤，又无常规化疗的不良反应。舒尼替尼为治疗转移性肾细胞癌一线药；口服，一次 50 mg，一日 1 次，连续给药 4 周，每 6 周重复 1 次。

8.15.2 肾母细胞瘤及其药物治疗

肾母细胞瘤（nephroblastoma）又称肾胚胎瘤、Wilms 瘤，是小儿泌尿系统最常见的恶性肿瘤，发病高峰在 3 ~ 4 岁。根据肾母细胞瘤的临床分期制订治疗方案，通常情况下，手术、放疗和化疗的联合治疗可以取得较好的疗效。对于早期局限性病变，可在肾切除术后进行辅助性化疗。对于局部晚期或已有转移的病变，可以在肾切除后进行腹部放疗加全身化疗。对于巨大肿瘤可以在手术前先进行放疗和化疗，待肿瘤缩小后再做肾切除术。肾母细胞瘤对放疗比较敏感。肾母细胞瘤常用的化疗药包括：放线菌素 D（ACD），长春新碱（VCR）和表柔比星。

常用化疗方案为：①长春新碱 - 放

线菌素D（VCR+ACD方案）。长春新碱1.4 mg/m^2，静脉注射，第1、8日；放线菌素D10～15μg/kg，静脉滴注，第1～5日。3周为1个周期。②长春新碱-多柔比星-放线菌素D方案（VCR+ADM+ACD）。长春新碱1.4 mg/m^2，静脉注射，第1、8日；多柔比星40 mg/m^2，静脉注射，第1日；放线菌素D 10～15μg/kg，静脉滴注，第1～5日。3周为1个周期。

8.15.3 肾盂输尿管癌及其药物治疗

虽然肾盂输尿管和膀胱覆盖同样的黏膜上皮，但其恶性肿瘤的发病率明显低于膀胱。最常见的病理类型是移行上皮癌。部分肾盂输尿管癌（pelvic ureteral cancer）患者在发病的同时或先后会发生膀胱癌，多器官多病灶发病是尿路上皮细胞肿瘤的特点。手术是肾盂输尿管癌的首选治疗方法。由于肾盂输尿管癌容易多器官发病，手术切除范围应包括患侧的肾脏、全长输尿管及输尿管开口附近的膀胱壁。对发生转移或复发的晚期病变，可采取吉西他滨（GEM）加顺铂（DDP）的化疗，疗效与以往的M-VAP化疗方案（甲氨蝶呤、长春碱、多柔比星和顺铂）相同，但不良反应明显减轻。

常用化疗方案是：吉西他滨-顺铂（GC方案）：吉西他滨800 mg/m^2，静脉滴注，第1、8、15日；顺铂70 mg/m^{2}静脉滴注，第2日。4周为1个周期，连续3周期。

8.15.4 膀胱癌及其药物治疗

膀胱癌（bladder cancer）是我国泌尿、男性生殖系统最常见的恶性肿瘤，其发病与化工染料接触、吸烟、某些药物有关。男女发病比为3∶1，发病高发年龄为40～70岁。常见的病理类型也是移行细胞癌，腺癌和鳞状细胞癌较少见。膀胱癌的治疗以手术为主。对于没有肌层浸润且分化良好的表浅性病变，可以采取保留膀胱的经尿道肿瘤切除术。这种治疗方式虽然可以保留膀胱的生理功能，但存在很高的术后复发率，少数患者还会发生转移。为减少经尿道膀胱肿瘤切除术后的复发，需定期进行膀胱内灌注化疗，常用的灌注药物有丝裂霉素、吡柔比星、表柔比星等。卡介苗（BCG）也可用于膀胱灌注，而且效果优于前述化疗药物，但不良反应也更严重。如果膀胱肿瘤分化差，或者浸润肌层，或反复复发，则应行根治性膀胱切除加尿流改道或新膀胱术。放疗对膀胱癌有一定疗效。如果发生转移，可采用吉西他滨加顺铂的化疗方案。

8.15.4.1 局部化学治疗

（1）丝裂霉素：膀胱内给药。一次40 mg，溶于0.9%氯化钠注射液60 ml，一周1次，6周为1个疗程；休息6周后复查若发现病变残存，可再灌注6周。

（2）吡柔比星：将本品加入5%葡萄糖注射液或注射用水10 ml溶解。用导尿管导尿后，15～30 mg溶成500～1 000μg/ml的溶液，膀胱内注入，一周1次，6周为1个疗程。

（3）表柔比星：膀胱内给药，一次50～60 mg，一周1次，6周为1个疗程。

8.15.4.2 局部免疫治疗

卡介菌多糖核酸制剂：为预防膀胱癌局部复发的灌注用药。膀胱灌注，一次120 mg，悬浮在0.9%氯化钠注射液50 ml中，一周1次，连续6次。对由感染性疾病导致的发热或未知病因的发热者不得使用，对免疫力降低的婴儿或儿童慎用，对结核菌素反应强阳性的患者慎用。患有急性传染病（麻疹、百日咳、肺炎等）、急性眼结膜炎、急性中耳炎及对本品有过敏史者禁用。

8.15.4.3 全身化疗

（1）单药治疗：①顺铂Cisplatin（DDP）。②甲氨蝶呤Methotrexate（MTX）。③吡柔比星Pirarubicin（THP-ADM）。④多柔比星Doxorubicin（ADM）。⑤表柔比星Epirubicin（EPI）。⑥环磷酰胺Cyclophosphamide（CTX）。

（2）联合用药方案：①甲氨蝶呤+长春碱+多柔比星+顺铂（MVAP）。甲氨蝶呤30 mg/m^2，静脉滴注，第1、15、22日；长春碱6 mg/m^2，静脉滴注，第3、

15、22日；多柔比星30 mg/m^2，静脉滴注，第2日；顺铂70 mg/m^2，静脉滴注，第2日；4周为1个周期，连续2～4周期。②环磷酰胺-多柔比星-顺铂（CAP）。环磷酰胺650 mg/m^2，静脉冲入，第1日；多柔比星50 mg/m^2，静脉冲入，第1日；顺铂70～100 mg/m^2，静脉滴注，第2日（加水化）。21～28日为1个周期，连续3周期。先用多柔比星，后用顺铂；在实施过程中将多柔比星剂量酌减，40 mg/m^{2}较适合中国人的体质。③吉西他滨-顺铂（GC）。吉西他滨800 mg/m^2，静脉滴注，第1、8、15日；顺铂70 mg/m^2，静脉滴注，第2日。4周为1个周期，连续3周期。GC方案的耐受性和安全性明显优于MVAP方案，可作为转移性移行细胞癌的标准方案。

8.15.5 前列腺癌及其药物治疗

前列腺癌（prostate cancer）在我国的发病率呈明显上升趋势。对于病灶尚局限在前列腺内的早期患者，可以根据患者的年龄及身体情况选择根治性前列腺切除术、前列腺放射性粒子植入术或是外照射治疗，均可获得满意疗效。对于已发生转移或复发的患者，可采取内分泌治疗。切除睾丸或注射黄体生成素释放激素（LHRH）类似物（如戈舍瑞林、亮丙瑞林），抑制睾丸产生雄激素，使血清睾酮水平下降，抑制前列腺癌的生长。对于肾上腺产生的少部分雄激素，可以采用抗雄激素类药（氟他胺等）。早期内分泌治疗效果良好，但经过一段时间之后，前列腺癌会再次进展，进入激素非依赖阶段，这时需采取化疗。以多西他赛为基础的方案为治疗激素非依赖性前列腺癌的一线方案。磷酸雌莫司汀也对激素非依赖前列腺癌有一定作用。针对前列腺癌易发生骨转移的特点，应用双磷酸盐类药物可以减少骨相关事件的发生。

8.15.5.1 内分泌治疗药

氟他胺 用于前列腺癌。口服，一次250 mg，一日3次。本品一般与促黄体激素释放激素类似物联合应用。且本品先使用7～10天后再开始使用促黄体激素释放激素类似物。（其他见10.3.2.3）

比卡鲁胺 [保(乙)]

Bicalutamide

【适应证】与黄体生成素释放激素（LHRH）类似物或外科睾丸切除术联合应用于晚期前列腺癌的治疗。

【注意事项】(1) 本品广泛在肝脏代谢。有数据表明，严重肝损害的病人药物清除可能会减慢，由此可能导致蓄积，所以本品对有中、重度肝损伤的病人应慎用。由于可能出现肝脏改变，应考虑定期进行肝功能检测。主要的改变一般在本品治疗的最初6个月内出现，严重的肝功能改变很少见于本品的治疗，如果出现严重改变应停止本品治疗。(2) 本品对肾损害病人无需调整剂量。(3) 本品显示抑制肝酶CYP_3A_4活性。因此当与主要由CYP_3A_4代谢的药物联合应用时应谨慎。(4) 本品不会影响病人驾驶及操作机器的能力。

【禁忌证】儿童、妇女、对本品过敏者。

【不良反应】常见面部潮红、瘙痒、乳房触痛和男性乳房女性化，可随睾丸切除术减轻；少见腹泻、恶心、呕吐、乏力和皮肤干燥；偶见肝功能异常（ALT及AST升高、黄疸）；极少见肝衰竭。

【用法与用量】口服：用于前列腺癌，成年男性包括老年人一次50 mg，一日1次，用本品治疗应与LHRH类似物或外科睾丸切除术联合应用。如与LHRH类似物联合治疗时，本品就先用7～10天后，再开始使用LHRH类似物。

【制剂与规格】比卡鲁胺薄膜衣片：50 mg。

亮丙瑞林 用于前列腺癌。成人每4周1次，皮下注射，醋酸亮丙瑞林3.75 mg。（其他见12.7）

戈舍瑞林 适用于可用激素治疗的前列腺癌。成人在腹部皮下注射戈舍瑞林3.6 mg，每28日1次。用植入剂，一次植入10.8 mg，每3个月植1次。（其他见12.7）

曲普瑞林 适用于可用激素治疗的前列腺癌。对前列腺癌作为去势治疗，每月肌内注射 1 次本品控释剂 3.75 mg。（其他见 12.7）

8.15.5.2 化疗药

雌莫司汀[保(乙)]

Estramustine (EM)

【适应证】用于晚期前列腺癌，尤其为激素难治性前列腺癌，对于预后因素显示对单纯激素疗法疗效差的患者，可作为一线治疗。

【注意事项】(1) 肝肾功能损害患者慎用。(2) 妊娠和哺乳期妇女不宜使用。(3) 血栓性静脉炎、血栓形成或有血栓栓塞病史（尤其是与雌激素治疗相关时）、与高血钙症有关的骨代谢疾病、脑血管及冠状动脉疾病以及溃疡病的患者均需慎用。(4) 用药期间应监测血压、肝功能。(5) 本品是以雌二醇 17 磷酸酯为载体的一种氮芥类烷化剂。已知雌二醇及氮芥均能致突变，故正在进行治疗的男性应采取避孕措施。(6) 由于本品可能使糖耐量降低，当接受本品治疗时，糖尿病患者应仔细监测。(7) 由于本品可引起体液潴留，故接受本品治疗的病人有报道出现已存在的或初发的周围性水肿加剧、充血性心脏疾患加剧，体液潴留还可能影响一些其他症状，如癫痫、偏头痛或肾功能不全，因此需要仔细观察。(8) 由于含雌激素的药物可影响相关的内分泌系统及肝功能，所以相应的实验室指标也会受影响。(9) 服用本品时，不可与奶制品或含钙药物同服。

【禁忌证】已知对雌二醇或氮芥类药物过敏者，严重肝脏、心血管疾病者，缺血性、血栓栓塞性或体液潴留所引发的并发症。

【不良反应】(1) 心血管系统：常见体液潴留，充血性心力衰竭，心脏缺血性疾病包括心肌梗死、血栓栓塞、高血压。(2) 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹泻，尤其在治疗的最初 2 周。(3) 肝 - 胆系统：肝功能受损、ALT 及 AST 和胆红素增高。(4) 血液系统：偶见贫血、白细胞减少和血小板减少。(5) 内分泌系统：常见男子女性化乳房和阳痿。(6) 中枢神经系统：偶见肌无力、抑郁、头痛、意识混乱和嗜睡。(7) 其他：有报道出现过敏反应包括皮肤过敏性皮疹及血管神经性水肿。

【用法与剂量】口服：用于前列腺癌，一次 280 ~ 420 mg，一日 2 次，餐前 1 小时或餐后 2 小时服。如服 3 ~ 4 周后无效，应立即停药；如有效可按原剂量继续服用，共 3 ~ 4 个月。

【制剂与规格】磷酸雌莫司汀胶囊：140 mg。

多西他赛 适用于前列腺癌进一步发展，进入激素非依赖阶段，这时需采取化疗，以多西他赛为基础的方案为治疗激素非依赖性前列腺癌的一线方案。只能用于静脉滴注。(1) 所有病人在接受多西他赛治疗期前均必须口服糖皮质激素类药物，如地塞米松，在多西他赛滴注一天前服用，一日 16 mg，持续至少 3 日，以预防过敏反应和体液潴留。(2) 临用前将本品以所提供的溶媒溶解，轻轻振摇混合均匀，将混合后的药瓶室温放置 5 分钟，然后检查溶液是否均匀澄明，根据计算病人所用药量，用注射器吸入混合液，注入 5% 葡萄糖注射液或 0.9% 氯化钠注射液的注射瓶或注射袋中，轻轻摇动，混合均匀，最终浓度不超过 0.9 mg/ml。(3) 本品的推荐剂量为 75 mg/m^2 静脉滴注 1 小时，每 3 周 1 次。（其他见 10.3.1.5）

8.15.5.3 联合化疗方案

多西他赛 - 泼尼松（DP 方案）：多西他赛 75 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；泼尼松口服，一次 5 mg，一日 2 次，第 1 ~ 21 日。每 3 周重复 1 次。

8.15.6 睾丸肿瘤

睾丸肿瘤（testicular cancer）并不常见，发病高峰在 30 岁左右，是青壮年男性最常见的实体恶性肿瘤。主要分为精原细胞瘤和非精原细胞瘤，而非精原细胞瘤则又分为胚胎癌、畸胎瘤、畸胎癌、绒癌和卵黄囊瘤。根治性睾丸切除加低剂量放疗是精原细胞瘤的标准治疗，而非精原细胞瘤的常规治疗是根治性睾丸切除加腹

膜后淋巴结清扫术。如果腹膜后转移淋巴结较大，可以先行化疗，然后再进行腹膜后淋巴结清扫术。标准的睾丸肿瘤化疗方案为顺铂、长春碱和博来霉素。对于膈上转移性或局部巨大病变，化疗能够治愈80%的患者。

8.15.6.1 睾丸精原细胞瘤

氮甲 用于治疗睾丸精原细胞瘤（testicular seminoma），疗效较突出。近期有效率91.3%，其中治后肿瘤消失及显著缩小的约63.8%。睾丸精原细胞瘤：成人一日剂量为150～200 mg 每千克体重3～4 mg），分3～4次或睡前1次口服（与氯丙嗪或异丙嗪在睡前同服可减轻不良反应），总剂量6～8 g为1个疗程。（其他见10.3.1.1）

8.15.6.2 睾丸非精原细胞瘤

（1）单药治疗：①顺铂 Cisplatin（DDP）（疗效最佳）。②长春瑞滨 Vinorelbine（VLB）。③博来霉素 Bleomycin，BLM，治疗睾丸非精原细胞瘤。成人一次15～30 mg（1.5万～3万 U），用0.9%氯化钠注射液2～3 ml 溶解，深部肌内注射，一周2～3次。如遇显著发热时，可适当减少剂量，1个疗程总量为300～400 mg（30万～40万 U）。静脉注射剂量同上，溶于0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液10～20 ml 中缓慢注射。

（2）联合化疗方案。①顺铂-依托泊苷-博来霉素（PEP）：该方案为治疗睾丸晚期非精原细胞瘤的一线治疗方案。顺铂20 mg/m^2，静脉滴注，第1～5日；依托泊苷120 mg/m^2，静脉滴注，第1、3、5日；博来霉素15 mg/m^2，静脉冲人，第2、9、16日。3周重复1次，连续3～4周期。②顺铂-长春瑞滨-博来霉素（PVP）。适用于预后不良的Ⅰ期非精原细胞瘤，已侵及精索或睾丸，切除后瘤标仍持续升高者；ⅡA～Ⅳ期的非精原细胞瘤；晚期难治的肿瘤复发或用药无效，采用挽救性化疗方案。顺铂：一日20 mg/m^2，静脉滴注，第1～5日；长春瑞滨2 mg/kg，静脉滴注，第2日；博来霉素：30 mg/m^2，静脉冲人，第2、9、16日。3周为1个疗程，连续4个疗程。

8.15.7 阴茎癌

95%以上的阴茎癌为鳞状细胞癌，基底细胞癌、恶性黑色素瘤和色素痣等类型少见。阴茎癌的治疗以外科切除为主，根据病变的大小和部位采取保留器官的局部切除、阴茎部分切除或阴茎全切尿道会阴造口术。对于有腹股沟淋巴结转移的患者，应进行腹股沟淋巴结清扫术。对于发生远处转移的患者，顺铂/5-FU或博来霉素/长春碱/甲氨蝶呤方案的化疗对阴茎癌有一定效果。

常用顺铂-氟尿嘧啶（FP）方案：顺铂100 mg/m^2，第1日，静脉滴注0.5小时；氟尿嘧啶1 000 mg/m^2，静脉滴注，第1～5日。每3周重复1次。

第 9 章 感染疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 流行性感冒
- 人感染高致病性禽流感
- 严重急性呼吸综合征
- 麻疹
- 流行性腮腺炎
- 流行性乙型脑炎
- 脊髓灰质炎
- 狂犬病
- 流行性出血热
- 登革热
- 流行性和地方性斑疹伤寒
- 黑热病
- 流行性脑脊髓膜炎
- 猩红热
- 百日咳
- 白喉
- 细菌性痢疾
- 伤寒和副伤寒
- 霍乱
- 新生儿破伤风
- 布氏杆菌病
- 炭疽
- 鼠疫
- 钩端螺旋体病
- 感染性心内膜炎
- 结核病
- 麻风病
- 病毒性肝炎
- 获得性免疫缺陷综合征（HIV/AIDS）
- 真菌感染

本章主要介绍用于微生物和寄生虫感染疾病的治疗药物及其选用原则和应用。包括抗细菌药、抗分枝杆菌药、抗真菌药、抗病毒药和抗寄生虫药等。

抗感染药物的合理应用是临床上非常重要也是非常复杂的问题。在选择药物时首先要考虑引起感染的可能病原体、感染部位和感染程度；其次要考虑患者的情况，如其年龄、肝或肾功能、基础疾病、免疫功能，对妊娠期还要考虑药物对胎儿的影响等。如需合并使用时尚需考虑药物的相互作用等。在开始抗感染治疗之前，尽量采集各种标本进行病原体检测。在病原体未明确之前需要应用药物治疗时，可根据临床经验治疗的原则选择最可能有效的药物，待病原体明确后再做调整。

正确使用治疗感染性疾病的药物，不仅对患者的疗效和预后至关重要，也对防止耐药病原体的生成及其传播有深远意义。在我国，由于认识不足和管理方面的原因，抗感染药，特别是抗菌药不合理应用的现象十分严重，已成为迫切需要解决的问题，如不重视，后果将极为严重。一方面增加了药品不良反应和药害事件，另一方面可诱导大量的耐药菌株生成和蔓

延，使一些本来高效的抗菌药不断减效甚至失效，治疗感染性疾病将会越来越困难，治疗费用越来越高，给人民的健康和生命安全造成极大威胁。

9.1 法定传染病及其药物治疗

临床医务工作者在遇到以下国家法定的传染病时，除给予正确的临床处理外，还要按规定及时向附近的疾病预防控制机构或者医疗机构报告。

根据《中华人民共和国传染病防治法》的规定，传染病分为甲类、乙类和丙类（表9-1）。

上述规定以外的其他传染病，根据其暴发、流行情况和危害程度，需要列入乙类、丙类传染病的，由国务院卫生行政部门决定并予以公布。

《中华人民共和国传染病防治法》还规定任何单位和个人发现传染病患者或者疑似传染病患者时，应当及时向附近的疾病预防控制机构或者医疗机构报告。

由于传染性疾病均有特定的病原体（细菌、病毒及寄生虫），多数已有针对病原体的有效药物，故应强调：①用抗感染药前先留取标本（如血液、脑脊液等），争取获得阳性病原体；②阳性结果应做药敏检测，并保留病原标本以备后续检测。③重症患者在未获得培养结果前，要及时按临床诊断进行经验治疗以策安全；④有效抗病原体处方药治疗，特别如结核病、梅毒、伤寒、鼠疫及病毒性肝炎等，既要安全合理选用处方药，又要注意合理疗程，务求做到根治，治愈患者，同时又按传染病防治法要求防止传染病扩散或引起流行。

各种法定传染病的药物治疗如下。

9.1.1 流行性感冒及其药物治疗

流行性感冒（influenza，简称流感）是由流感病毒引起的急性呼吸道传染病，病原体分甲、乙、丙3型。流行性感冒病毒通过飞沫传播，临床表现为起病急、高热、乏力、全身肌肉酸痛和轻度呼吸道症状，病程短，自限性经过。老年人和伴有慢性呼吸道疾病或心脏病患者易并发肺炎。

◆ 抗病原治疗：①金刚烷胺或金刚乙胺：发病最初1～2日给金刚烷胺，成人，一日100～200 mg，分2次服；儿童，一日4.4～8.8 mg/kg，分2次服用；疗程均为5～7日。②奥司他韦：感冒后48小时内服用，成人，一日150 mg；儿童，一日3 mg/kg，分2次口服；疗程均为5日。

◆ 对症治疗：①高热与全身痛较重者用镇痛解热药。②发病初1～2日用中药，如感冒冲剂、板蓝根冲剂。

◆ 说明：① 65岁以上肾功能衰退的老年患者应减少剂量。②儿童慎用阿司匹林。

表9-1 法定传染病的类别和病种

分类	病种
甲类（2种）	鼠疫、霍乱
乙类传染病（26种）	严重急性呼吸综合征、获得性免疫缺陷综合征、病毒性肝炎、脊髓灰质炎、人感染高致病性禽流感、麻疹、流行性出血热、狂犬病、流行性乙型脑炎、登革热、炭疽、细菌性和阿米巴性痢疾、肺结核、伤寒和副伤寒、流行性脑脊髓膜炎、百日咳、白喉、新生儿破伤风、猩红热、布氏杆菌病、淋病、梅毒、钩端螺旋体病、血吸虫病、疟疾、甲型H1N1流感
丙类传染病（12种）	流行性感冒、流行性腮腺炎、风疹、急性出血性结膜炎、麻风病、流行性和地方性斑疹伤寒、黑热病、包虫病、丝虫病，除霍乱、细菌性和阿米巴性痢疾、伤寒和副伤寒以外的感染性腹泻病、手足口病

9.1.2 人感染高致病性禽流感及其药物治疗

人感染高致病性禽流感（human high pathogenic avian influenza，简称禽流感）是由甲型流感病毒某些亚型引起的一种禽类疾病，有可能感染人类，其中以 H5N1 亚型引起的临床症状最重。主要表现为发热、咳嗽、全身不适。重症病例可合并肺炎和全身多脏器功能损伤，病死率高。

◆ 抗病原治疗：①奥司他韦：成人一日 150 mg、儿童一日 3 mg/kg，均分为 2 次口服，疗程 5 日。②金刚烷胺：成人一日 100 ~ 200 mg、儿童一日 5 mg/kg，均分为 2 次口服，疗程 5 日。

◆ 对症治疗：①对疑似和确诊患者应进行隔离治疗。②对症治疗可应用解热药、缓解鼻黏膜充血药、止咳祛痰药等。③急性肺损伤或急性呼吸窘迫综合征（ARDS）时应用呼吸机支持治疗。

◆ 说明：①儿童慎用阿司匹林或含阿司匹林以及其他水杨酸制剂。②应用金刚烷胺和金刚乙胺时应注意中枢神经系统和胃肠道不良反应。肾功能受损者酌减剂量。有癫痫病史者禁用。

9.1.3 严重急性呼吸综合征及其药物治疗

严重急性呼吸综合征（sever acute respiratory syndrome，SARS），是一种因感染 SARS 相关冠状病毒而导致的以发热、干咳、胸闷为主要症状的传染病，严重者出现快速进展的呼吸系统衰竭。

◆ 抗病原治疗：可试用洛匹那韦（200 mg）- 利托那韦（50 mg）片，一次 2 片，一日 2 次。

◆ 对症治疗：①发热，可使用解热镇痛药。高热者给予物理降温。②糖皮质激素。应用指征为：有严重中毒症状，高热 3 日不退；48 小时内肺部阴影进展超过 50%；急性肺损伤或 ARDS；一般成人剂量相当于甲泼尼松一日 80~160 mg，短期应用。③呼吸困难或衰竭者及时应用无创正压机械通气或有创正压机械通气治疗。

◆ 说明：①儿童慎用阿司匹林。②应用糖皮质激素时需注意其不良反应，儿童慎用。

9.1.4 麻疹及其药物治疗

麻疹（measles）是由麻疹病毒引起的急性呼吸道传染病，目前尚无特效治疗，重点加强护理，对症处理，防治并发症。

◆ 对症治疗：无针对病原的特效治疗。

◆ 并发症治疗：①细菌性肺炎：根据病情给予青霉素等抗菌药治疗。②心力衰竭：毒毛花苷 K 一次 0.005 ~ 0.007 mg/kg，缓慢静脉注射。或毛花苷 C，<2 岁 0.03 ~ 0.04 mg/kg，> 2 岁 0.02 ~ 0.03 mg/kg，静脉注射。或地高辛，<2 岁 0.05 ~ 0.06 mg/kg，> 2 岁 0.03 ~ 0.05 mg/kg（总量不超过 1.5 mg），口服；静脉注射为口服量的 1/2 ~ 2/3。

说明：降温治疗时，应避免急骤退热。

9.1.5 流行性腮腺炎及其药物治疗

流行性腮腺炎（mumps）是由腮腺炎病毒引起的急性呼吸道传染病。疾病良性且呈自限性，但有时可合并睾丸炎、附睾炎、脑膜炎、胰腺炎等并发症而使病情加重。

◆ 对症治疗：无针对病原的特效治疗。局部治疗：外敷如意金黄散、紫金锭、青黛散。

◆ 对并发症治疗：①脑膜炎、脑膜脑炎：20% 甘露醇，一次 1 ~ 2 g/kg，快速静脉滴注，30 分钟内滴完，6 ~ 8 小时 1 次，至头痛基本消失停用。②睾丸炎：口服泼尼松，一日 20 ~ 40 mg，疗程 3 ~ 5 日。③胰腺炎：同急性胰腺炎治疗。

9.1.6 流行性乙型脑炎及其药物治疗

流行性乙型脑炎（epidemic encephalitis B）是由乙脑病毒引起的，经蚊传播，多见于夏、秋季。临床上急起发病，有高热意识障碍、惊厥、强直性痉挛和脑膜刺激征等，重型患者病后往往留有后遗症。

◆ 对症治疗：无针对病原的特效治疗。①高热：可采用物理降温或药物降温，使体温保持在 38 ~ 39℃（肛温）。②惊厥：可使用镇静止惊药，如地西泮一次 5 ~ 10 mg，肌内注射或静脉注射；水合

氯醛一次 8 mg/kg 或 250 mg/m^2，最大限量为 500 mg，一日 3 次。苯妥英钠一次 0.125 ~ 0.25 g,1 日总量不超过 0.5 g 等。③脑水肿：20% 甘露醇（1 ~ 1.5 g/kg），同时可合用呋塞米、肾上腺皮质激素等。

◆ 对并发症治疗：因脑水肿、脑疝而致呼吸衰竭者可给予脱水药、肾上腺皮质激素等。必要时使用人工呼吸机治疗。

◆ 说明：康复治疗的重点在于智力、吞咽、语言和肢体功能等的锻炼，可采用理疗、体疗、中药、针灸按摩、推拿等治疗手段。

9.1.7 脊髓灰质炎及其药物治疗

脊髓灰质炎（poliomyelitis）又名小儿麻痹症，是由脊髓灰质炎病毒引起的一种急性传染病。临床表现主要有发热、咽痛和肢体疼痛，部分患者可发生弛缓性麻痹，损害严重者可有后遗症。

◆ 对症治疗：本病无针对病原的特效治疗。①早期患者，静脉注射丙种球蛋白，一日 200 ~ 500 mg，连续 2 ~ 3 日；泼尼松口服或氢化可的松静脉滴注，一般用 3 ~ 5 日。②瘫痪停止进展后应用加兰他敏，肌内注射，一次 0.05 ~ 0.1 mg/kg，一日 1 次，疗程 2 ~ 6 周。

◆ 对并发症治疗：①延髓麻痹：有吞咽困难应右侧卧位头部放低，使与地面成 20° ~ 30°，以利呼吸道引流；加强吸痰保持呼吸道通畅；必要时需做气管切开；鼻饲。②脊髓麻痹影响呼吸肌功能时应采用机械通气。呼吸肌麻痹和吞咽障碍同时存在时，应行气管切开与机械通气。

◆ 说明：在热退尽、瘫痪不再进行时，及早康复治疗。

9.1.8 狂犬病及其药物治疗

狂犬病（rabies）是狂犬病病毒所致的急性传染病，人畜共患，多见于犬、狼、猫等肉食动物，人多因病兽咬伤而感染。临床表现为特有的恐水怕风、咽肌痉挛、进行性瘫痪等。恐水症状比较突出，故本病又名“恐水症”。

◆ 对症治疗：无针对病原的特效治疗。①安静卧床休息，防止一切声、光、风的刺激。②高热者用冷褥，体温过低者给予热毯，血容量过低或过高者，应及时予以调整。③有恐水时应禁食、禁饮、尽量减少各种刺激。痉挛发作可予苯妥英钠一次 0.125 ~ 0.25 g，1 日总量不超过 0.5 g；地西泮一次 5 ~ 10 mg，肌内注射或静脉注射。

◆ 对并发症治疗：①神经系统：脑水肿可予甘露醇及呋塞米等脱水药。②心血管系统：低血压者予扩容补液及血管活性药物。心力衰竭者限制水分，应用地高辛等强心药。

◆ 说明：①应单室严格隔离，专人护理。②医护人员须戴口罩、穿隔离衣及手套。③患者的分泌物、排泄物及其污染物，均须严格消毒。

9.1.9 流行性出血热及其药物治疗

流行性出血热（epidemic hemorrhagic fever，EHF）又称肾综合征出血热，是汉坦病毒引起的自然疫源性疾病。本病的主要病理变化是全身小血管和毛细血管广泛性损害，临床上以发热、低血压、出血、肾脏损害等为特征。

◆ 抗病毒治疗：利巴韦林 1 g，溶于葡萄糖液中静脉滴注，一日 1 次，疗程 3 ~ 4 日。

◆ 对症治疗：①发热期：应补充足够的液体和电解质。输液以葡萄糖和氯化钠为主。高热、中毒症状重者可用肾上腺皮质激素治疗。②低血压期：给予扩容、纠正酸中毒和抗休克治疗。③少尿期：严格控制液体入量，可用呋塞米、依他尼酸利尿。肾衰竭时给予透析治疗。④多尿期：补充足量的液体和钾盐，以口服为主静脉为辅。

◆ 说明：①吗啉胍应在发热期使用。②发热期避免使用强退热药物，避免脱水。

9.1.10 登革热及其药物治疗

登革热（dengue fever）是由登革病毒引起经蚊传播的急性传染病。以发热、皮疹、肌肉及骨关节剧烈酸痛、淋巴结肿大、白细胞减少等为主要表现，预后良好。重者表现为登革出血热，以发热、皮疹、出血、休克等为主要特征，病死率较高。

◆ 对症治疗：本病无特效针对病原治

疗。①中毒症状重者，短期使用小剂量肾上腺皮质激素，如口服泼尼松5 mg，一日3次。②有出血倾向，用卡巴克络一次5～10 mg，一日2次；酚磺乙胺，一日1 g。出血量较大者，可给予输新鲜全血或血小板，大剂量维生素K_1一次10 mg，一日1～2次，肌内或深部皮下注射；口服云南白药。

◆ 对并发症治疗：①休克：扩充血容量，可用血浆和代血浆。②DIC：按DIC处理。③脑水肿：应及时脱水；同时应用糖皮质激素，如地塞米松一次5～10 mg，以降低颅内压，防止脑疝发生。

◆ 说明：①对有明显出血症状的患者，应避免乙醇擦浴。②解热镇痛药可诱发G-6-PD缺乏的患者发生溶血，应谨慎使用。

9.1.11 流行性和地方性斑疹伤寒及其药物治疗

流行性斑疹伤寒（epidemic typhus）是由普氏立克次体引起；地方性斑疹伤寒（endemic typhus）是由莫氏立克次体引起，临床主要表现为发热、头痛、皮疹及中枢神经系统症状。广谱抗菌药的疗效好。

◆ 抗病原治疗：首选多西环素，口服，成人一次200～300 mg，一日1次，小儿用量酌减；疗程3～5日。次选四环素：成人一日2 g，小儿一日25 mg/kg，分3～4次口服，体温正常后继续用药3日。或环丙沙星，一次0.5 g，每12小时1次，连服3日；或氧氟沙星，一次0.2 g，每12小时1次，静脉滴注，连用3日。也可合用甲氧苄啶，成人一日0.2～0.4 g，分2次服。

◆ 说明：有严重毒血症者可短期使用糖皮质激素，如琥珀酸氢化可的松，100～200 mg，静脉滴注，一日1次，连用2～3日或地塞米松5～10 mg，静脉滴注，一日1次，连用2～3日。

9.1.12 病毒性肝炎及其药物治疗

见9.6。

9.1.13 流行性脑脊髓膜炎及其药物治疗

流行性脑脊髓膜炎（epidemic cerebrospinal meningitis）是由脑膜炎双球菌引起的化脓性脑膜炎。以发热、头痛、呕吐、皮肤瘀点及颈项强直等脑膜刺激征为主要临床特点。

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，成人，一日800万～1 200万U；儿童，一日20万U/kg，均为每8小时或每6小时1次。次选：①头孢菌素：头孢曲松钠，宜用于不能应用青霉素的重症患者。成人，一日2 g；儿童一日100 mg/kg。②氯霉素：首剂为50 mg/kg，继而一日5～100 mg/kg，成人一日最高量可达4 g，分次静脉滴注或口服。

◆ 对症治疗：①休克：扩容、纠正酸中毒。如休克仍未纠正，可应用血管活性药物。必要时应用强心药及肾上腺糖皮质激素。②DIC：疑有DIC，宜尽早应用肝素，剂量为0.5～1.0 mg/kg。③脑水肿：20%甘露醇，一次1～2 g/kg，根据病情可按每4、6或8小时静脉快速滴注。

◆ 说明：①应密切注意氯霉素对骨髓的抑制作用。②使用肝素时，应密切根据凝血时间监测，调整剂量。

9.1.14 猩红热及其药物治疗

猩红热（scarlet fever）是由A组β溶血性链球菌感染引起的急性呼吸道传染病，以发热、咽炎及皮疹为主要特征。

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，成人，一次400万～800万U；儿童，一次10万～20万U/kg；均为一日3～4次，疗程7～10日。次选：红霉素20～40 mg/kg或头孢菌素类药。疗程不少于7日。

◆ 说明：①重者可静脉给药或两种抗生素联合应用。②抗生素使用要注意疗程。

9.1.15 百日咳及其药物治疗

百日咳（whooping cough）是小儿常见的急性呼吸道传染病，由百日咳杆菌感染引起。其特征为阵发性痉挛性咳嗽，咳嗽末伴有特殊的吸气吼声，病程较长，可达数周甚至3个月左右，故有“百日咳”之称。

◆ 抗病原治疗：首选红霉素，一日30～50 mg/kg，最大剂量一日2 g，分

3～4次口服，连服7～14日。次选复方磺胺甲噁唑（TMP 8 mg/kg及SMZ 40 mg/kg），疗程14～21日。也可选用罗红霉素，阿奇霉素。

◆ 说明：①祛痰止咳治疗，如沙丁胺醇0.5 mg/kg、氯丙嗪等。②百日咳脑病时可用脱水治疗。

9.1.16 白喉及其药物治疗

白喉（diphtheria）是由白喉杆菌引起的急性呼吸道传染病，其临床特征是咽、喉、鼻等处有假膜形成伴有全身中毒症状，如发热、乏力、恶心呕吐、头痛等，严重者可并发心肌炎和神经瘫痪。

◆ 抗毒素治疗：在病程初3日应用效果较好。咽白喉假膜局限在扁桃体者，剂量2万～4万U。假膜范围广泛、中毒症状重者，剂量4万～10万U。喉白喉和鼻白喉者，剂量1万～3万U。发病3日后治疗者剂量加倍。24小时后病变继续扩大者可重复使用。

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，一日600万U，疗程7～10日，用至症状消失和白喉杆菌培养阴转为止。次选红霉素，一日40 mg/kg，分4次口服或静脉注射，疗程7～10日。

◆ 对并发症治疗：①心肌炎：可用泼尼松一日20～40 mg，口服。②喉梗阻：气管切开，并在切开处钳取假膜，或滴入胰蛋白酶或糜蛋白酶以溶解假膜。

◆ 说明：抗毒素治疗前应做皮肤过敏试验，阳性者按脱敏法给予。

9.1.17 细菌性痢疾及其药物治疗

细菌性痢疾（bacillary dysentery）是由志贺菌属（又称痢疾杆菌）引起的肠道传染病。临床主要表现为腹痛、腹泻、里急后重和黏液脓血便，严重者可有感染性休克和中毒性脑病。

◆ 抗毒素治疗：首选：①普通型痢疾，用喹诺酮类如诺氟沙星，口服，成人一次0.2～0.4 g，一日4次，疗程5～7日。②中毒性痢疾：环丙沙星，静脉滴注，一日0.2～0.4 g，病情好转后改用口服；或三代头孢菌素等抗菌药。次选复方磺胺甲噁唑片，成人，一次2片，一日2次，首剂加倍；儿童剂量酌减。也可用二代或三代头孢菌素。

◆ 说明：有药敏结果时则根据药敏结果选用抗菌药物。

9.1.18 伤寒和副伤寒及其药物治疗

伤寒（typhoid fever）和副伤寒（parathyroid fever）是由伤寒杆菌、副伤寒杆菌引起的急性传染病，典型的临床表现包括持续高热、玫瑰疹和相对缓脉、神经系统中毒症状、消化道症状、肝脾大及白细胞低下等。

◆ 抗病原治疗：首选：①氟喹诺酮类药，左氧氟沙星400 mg，一日2次，口服或静脉滴注，疗程14日。环丙沙星，一次500 mg，一日2次，或每8小时1次，口服或静脉滴注，疗程14日。②头孢菌素类如头孢曲松钠，成人一次2 g，一日1次，静脉滴注；儿童，一日100 mg/kg；疗程14日。或用头孢噻肟，成人一次1～2 g，每12小时1次，静脉滴注；儿童，一日100～150 mg/kg，疗程14日。次选：①氨苄西林，成人一日2～6 g；儿童，一日100～150 mg/kg，分3～4次口服或静脉滴注。②阿莫西林，成人一日2～4 g，分3～4次口服，疗程14日。

◆ 对并发症治疗：①肠出血：酌量输血；禁用泻药及灌肠；内科治疗无效应考虑手术治疗。②肠穿孔：除局限者外，应及早手术治疗，同时控制腹膜炎。

◆ 说明：氟喹诺酮类药物因其影响骨骼发育，孕妇儿童禁用；哺乳期妇女慎用。

9.1.19 霍乱及其药物治疗

霍乱（cholera）是由霍乱弧菌所致烈性肠道传染病，临床上以剧烈无痛性泻吐米泔样大便、严重脱水，肌肉痛性痉挛及周围循环衰竭等为特征。

◆ 抗病原治疗：首选诺氟沙星，口服，一次0.2 g，一日2次，亦可静脉滴注。次选多西环素、复方磺胺甲噁唑片、四环素。

◆ 对症治疗：①按脱水程度补液：入院后最初2小时应快速输液以尽快纠正低血容量休克及酸中毒：轻型补液3 000～4 000 ml，小儿100～500 ml/kg；中型补

液 4 000 ~ 8 000 ml，小儿 150 ~ 200 ml/kg；重型补液 8 000 ~ 12 000 ml，小儿 200 ~ 250 ml/kg。② 纠正休克及酸中毒：氯化钠注射液与 1/6 mol/L 的乳酸钠或碳酸氢钠；见有尿液后可行补钾。

◆ 说明：属甲类传染病，需按消化道传染病严密隔离至症状消失 6 日后、粪便弧菌连续 3 次阴性方可解除隔离。

9.1.20 新生儿破伤风及其药物治疗

破伤风（tetanus）是由破伤风杆菌侵入人体伤口，生长繁殖，产生毒素所引起的一种急性特异性感染，目前以新生儿多见。

◆ 抗毒素治疗：破伤风抗毒素：1 万~3 万 U，一次静脉滴注或肌内注射。

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，一日 5 万~ 10 万 U/kg，每 8 小时或每 6 小时 1 次，静脉滴注。次选头孢菌素、亚胺培南，也可选用大环内酯类抗生素。

◆ 对症治疗：惊厥，大量使用抗惊厥药和镇静药，控制痉挛发作。

9.1.21 布氏杆菌病及其药物治疗

布氏杆菌病（brucellosis）又称布鲁杆菌病、波状热，是由布鲁杆菌引起的人畜共患的传染病。其临床特点为长期发热、多汗、关节痛、睾丸炎、肝脾大等。

(1) 急性布氏杆菌病

◆ 抗病原治疗：首选多西环素一日 200 mg，加利福平一日 600 ~ 900 mg；疗程 6 周。次选四环素，一日 2 g，分 4 次分服，3 ~ 5 日热退后，剂量可减为一日 1.5 g；也可联用阿米卡星，肌内注射，一次 0.4 g，一日 1 次。

◆ 说明：中毒症状明显和睾丸炎严重者可适当应用糖皮质激素治疗。

(2) 布氏杆菌骨髓炎

◆ 抗病原治疗：首选四环素，口服，一日 2 g 加阿米卡星，一次 0.4 g，一日 1 次，肌内注射。亦可试用氯霉素与庆大霉素合用。疗程 2 ~ 3 个月。

◆ 对并发症治疗：应予彻底清创辅以长期抗菌治疗。

(3) 布氏杆菌心内膜炎

◆ 对病原治疗：首选四环素，口服，一日 2 g 加阿米卡星一次 0.4 g，一日 1 次，肌内注射；四环素治疗疗程 2 ~ 3 个月。次选四环素与庆大霉素或复方磺胺甲噁唑联合加用利福平。

9.1.22 炭疽及其药物治疗

炭疽（anthrax）是由炭疽杆菌所致一种人畜共患的急性传染病。临床上主要表现为皮肤坏死、溃疡、焦痂和周围组织广泛水肿及毒血症症状，可引起肺、肠和脑膜的急性感染，并可伴发败血症。

(1) 皮肤炭疽

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，成人一次 200 万 ~ 400 万 U；儿童，20 万 U/kg，静脉注射，每 8 小时或每 6 小时 1 次，疗程 7 ~ 10 日。次选：① 左氧氟沙星，一次 400 mg，静脉注射，一日 2 次。② 多西环素，口服，成人，一次 100 ~ 200 mg，一日 2 次。

◆ 对并发症治疗：局部皮肤病灶外切忌挤压，也不宜切开引流，以防感染扩散而发生败血症。局部可用 1 : 2 000 高锰酸钾液洗涤，涂敷四环素软膏，用消毒纱布包扎。

(2) 肺炭疽、肠炭疽、脑膜炎炭疽和败血症炭疽

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，一日 1 000 万 ~ 2 000 万 U，每 8 小时或每 6 小时 1 次，静脉注射；同时合用氨基糖苷类（阿米卡星、庆大霉素等），疗程 4 ~ 6 周。也可加用环丙沙星，一次 400 mg，静脉注射，每 12 小时 1 次，或用克林霉素，一次 600 mg，静脉注射；或口服，每 10 小时 1 次。

◆ 说明：重症可用糖皮质激素，如氢化可的松，一日 100 ~ 200 mg，短期静脉滴注。

9.1.23 鼠疫及其药物治疗

鼠疫（plague）是由鼠疫杆菌借鼠蚤传播为主的烈性传染病，系广泛流行于野生啮齿动物间的一种自然疫源性疾病。临床上表现为发热、严重毒血症症状、淋巴结肿大、肺炎、出血倾向等。

(1) 腺鼠疫

◆ 抗病原治疗：首选链霉素，成人，

肌内注射，首剂1g，以后一次0.5g，每12小时1次；小儿一日10～20mg/kg，新生儿一日10mg/kg，分2次注射。疗程一般7～10日。次选：①多西环素，轻症者1、2日，一次100～200mg，一日2次，口服，疗程7～10日。②复方磺胺甲噁唑，一次2片，一日3～4次，热退后改为一日2次。亦可应用三代头孢菌素和氟喹诺酮类药物。

◆ 对并发症治疗：①肿大淋巴结可用抗菌药物外敷，其周围组织内注入链霉素。已软化者在应用足量抗菌药物24小时以上可切开排脓。②对严重毒血症患者可短期应用肾上腺皮质激素，如100～300mg氢化可的松静脉滴注。③眼鼠疫可用四环素、氯霉素、红霉素等眼用制剂。④皮肤鼠疫可用抗菌药液湿敷冲洗或抗菌药软膏外敷。

◆ 说明：小儿及孕妇慎用氯霉素。

(2) 肺鼠疫或败血型鼠疫

◆ 抗病原治疗：首选：①阿米卡星。成人，一次0.4g，静脉滴注或肌内注射，一日1次。体温正常后改为一次0.4g，静脉滴注或肌内注射，隔日1次，持续3～5日，最长总疗程15日。②联合用药。阿米卡星加氯霉素或多西环素。次选：①氯霉素，开始2日宜用较大量，成人一次0.5～1g，静脉注射，每12小时1次，加多西环素100～200mg，一日2次，疗程7～14日。②三代头孢菌素和氟喹诺酮类药物也可联合使用。

◆ 说明：肺鼠疫患者应严密呼吸道隔离。隔离到症状消失、血液或局部分泌物每3天培养1次且检菌3次阴性、肺鼠疫痰培养3日1次且6次阴性始解除隔离。

9.1.24 肺结核和麻风病及其药物治疗

见9.4。

9.1.25 淋病和梅毒及其药物治疗

见16.14.1和16.14.2。

9.1.26 钩端螺旋体病及其药物治疗

钩端螺旋体病（leptospirosis）是由致病钩端螺旋体引起的急性传染病，临床表现为急性发热与全身酸痛，轻者数日内自愈。重者可并发肺出血、黄疸、肾衰竭或脑膜炎。

◆ 抗病原治疗：首选青霉素，尽量早用，一次200万U，静脉注射，每8小时或每6小时1次；小儿，一日5万U/kg，分4～6次，静脉注射，疗程5～7日。次选：青霉素过敏者可用庆大霉素，一日16～24万U，分2次肌内注射，或用多西环素，100～200mg，一日2次，口服，疗程7日。

◆ 说明：注意首次剂量不可过大，以防出现赫氏反应，用药同时或用药前，给予氢化可的松150～300mg，加入5%葡萄糖注射液200ml稀释后静脉滴注。

9.1.27 疟疾、黑热病、阿米巴痢疾、血吸虫病、丝虫病和包虫病及其药物治疗

见9.8。

9.2 微生物感染及其药物治疗

9.2.1 脑膜炎及其药物治疗

脑膜炎（meningitis）可由多种病原菌引起，脑脊液细菌涂片或培养检出病原菌可明确诊断。化脓性脑膜炎的治疗应针对病原菌选择敏感、足量以及容易透过血脑屏障的抗生素。

(1) 初始经验治疗

常见的病原菌有肺炎链球菌、脑膜炎奈瑟菌、B族链球菌、肠球菌属、葡萄球菌属、类白喉杆菌、流感嗜血杆菌、李斯特菌属、念珠菌属。

◆ 首选药物：急重症患者迅速收住院。若疑似细菌性脑膜炎，特别是脑膜炎奈瑟菌性疾病，一般应该在转院前给予青霉素，一次400万U，静脉滴注，每6小时1次。

◆ 次选药物：青霉素类过敏可以用头孢噻肟，一次2g，静脉滴注，每12小时1次。或头孢曲松，一次1g，静脉滴注，每12小时1次。有青霉素严重过敏者或头孢类过敏史可以用氯霉素替代，一次0.5～1g，静脉滴注，每12小时1次。

◆ 说明：合用地塞米松辅助治疗（特别是成人的疑似肺炎链球菌性脑膜炎），可在治疗开始前或初始剂量抗菌药的同时

给予，在败血症休克、脑膜炎奈瑟菌脑膜炎或免疫受损或外科手术后脑膜炎时应避免应用地塞米松。

（2）肺炎链球菌感染

①青霉素敏感株

◆ 首选药物：青霉素，一日 80 万 U/kg，分 4 ~ 6 次静脉滴注。或氨苄西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。

◆ 次选药物：头孢曲松，一次 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢噻肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或氯霉素，一次 0.5 ~ 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 说明：如有必要可以加用利福霉素，一次 0.5 g，静脉滴注，一日 2 ~ 3 次。考虑早期合用地塞米松辅助治疗（可以减少万古霉素向脑脊液的渗透）。应用去甲万古霉素时要监测血药浓度。

②青霉素中介株

◆ 首选药物：头孢曲松，一次 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢噻肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：美罗培南，一次 0.5 g，静脉滴注，每 8 ~ 12 小时 1 次；去甲万古霉素，一次 0.8 ~ 1.6 g，静脉滴注，一日 1 次。加（或不加）头孢曲松，一次 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 说明：如有必要可以加用利福霉素，一次 0.5 g，静脉滴注，一日 2 ~ 3 次。考虑早期合用地塞米松辅助治疗（可以减少万古霉素向脑脊液的渗透）。应用去甲万古霉素时要监测血药浓度。

③青霉素耐药株

◆ 首选药物：去甲万古霉素，一次 0.8 ~ 1.6 g，静脉滴注，一日 1 次；加头孢曲松或头孢噻肟，剂量同上。

◆ 次选药物：美罗培南，一次 0.5 g，静脉滴注，每 8~12 小时 1 次。治疗 10~14 日。

◆ 说明：同上。

（3）流感嗜血杆菌感染

◆ 首选药物：①非产酶株：氨苄西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。②产酶株：头孢曲松，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，一日 1 次。或头孢噻肟，一次 1.5 ~ 3 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：①非产酶株：头孢噻肟，一次 1.5 ~ 3 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢曲松，一次 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或氯霉素，一次 0.5 ~ 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。②产酶株：氯霉素，一次 0.5 ~ 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢吡肟，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或氟喹诺酮类。

◆ 说明：如考虑早期合用地塞米松辅助治疗。对 B 型流感嗜血杆菌性脑膜炎在出院前使用 4 日的利福霉素，一次 0.5 g，静脉滴注，一日 2 ~ 3 次。

（4）李斯特菌属感染

◆ 首选药物：阿莫西林，一次 1 g，口服，一日 3 次。或氨苄西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。加奈替米星，一日 4 ~ 6.5 mg/kg，分 2 ~ 3 次静脉滴注。

◆ 次选药物：复方磺胺甲噁唑，一次 2 片，口服，一日 2 次，疗程 10 ~ 14 日。

（5）脑膜炎奈瑟菌感染

◆ 首选药物：①敏感菌（MIC<0.1 mg/L）：青霉素，一日 240 万 ~ 2 000 万 U，分 2 ~ 4 次静脉滴注。或氨苄西林，一次 1 ~ 2g，静脉滴注，每 6 小时 1 次。②相对耐药菌株（MIC 0.1 ~ 1 mg/L）：用头孢曲松，一次 2g，静脉滴注，一日 1 次或每 12 小时 1 次。或头孢噻肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：①敏感菌：头孢曲松，一次 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢噻肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或氯霉素，一次 0.5 ~ 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或磺胺嘧啶，一次 1 ~ 1.5 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。②耐药株：喹诺酮类药物。或氯霉素，一次 0.5 ~ 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

（6）金黄色葡萄球菌感染

①甲氧西林敏感菌

◆ 首选药物：苯唑西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。或氯唑西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。

◆ 次选药物：去甲万古霉素（青霉素过敏者），一次 0.8 g，每 12 小时 1 次。

◆ 说明：应用去甲万古霉素时要监测

血药浓度。

②甲氧西林耐药菌

◆ 首选药物：去甲万古霉素，一次15 mg/kg，静脉滴注，每12小时1次。加磷霉素，一次2～4 g，静脉滴注，每6小时或每8小时1次。

◆ 次选药物：去甲万古霉素，一次15 mg/kg，静脉滴注，每12小时1次。加利福平，一次0.3 g，口服，一日3次。

◆ 说明：应用去甲万古霉素时要监测血药浓度。

9.2.2 呼吸系统感染的药物治疗

9.2.2.1 急性气管支气管炎

急性气管支气管炎（acute tracheo-bronchitis），也即急性支气管炎。

◆ 可能病原菌：通常为病毒，少部分为肺炎支原体或肺炎衣原体。

◆ 首选药物：一般无抗生素应用指征。止咳药加（或不加）吸入支气管扩张药。

◆ 次选药物：阿奇霉素，口服，首日500 mg，第2～5日250 mg，均为一日1次。或克拉霉素，口服，一次500 mg，一日2次，疗程7～14日。或罗红霉素，口服，一次150mg，一日2次，疗程7～14日。

◆ 说明：咳嗽约持续2周；如仅有脓性痰，则不是抗菌药治疗的指征；如有发热或寒战，需行胸片、血常规检查。衣原体感染用抗菌药时须适当延长疗程。

9.2.2.2 慢性支气管炎急性加重

慢性支气管炎急性加重（acute exacer-bation of chronic bronchitis，AECB），多数为吸烟的慢性阻塞性肺疾病患者。

◆ 可能病原菌：病毒感染占20%～50%；其他为肺炎衣原体、肺炎支原体、肺炎链球菌、流感杆菌、卡他莫拉菌；与吸烟及空气污染有关。

◆ 首选药物：阿莫西林克拉维酸，口服，一次500 mg/125 mg，一日3次。或头孢呋辛，口服，一次500 mg，每12小时1次，加（或不加）阿奇霉素或克拉霉素，剂量同急性支气管炎。疗程7～10日。

◆ 次选药物：左氧氟沙星，口服，一次400 mg，一日1次；或一次200 mg，每12小时1次。或莫西沙星，口服，一次400 mg，一日1次。疗程7～14日。

◆ 说明：同时吸入抗胆碱类支气管扩张药，加（或不加）吸入β受体激动药，必要时加用吸入或口服皮质激素。

9.2.2.3 社区获得性肺炎

社区获得性肺炎（communit y-acquired pneumonia）的治疗如下。

（1）青壮年，无基础疾病者

◆ 可能病原菌：肺炎链球菌、肺炎支原体、流感杆菌、肺炎衣原体等。

◆ 首选药物：青霉素，静脉滴注，一次240万U，每6小时或4小时1次。或阿莫西林，口服，一次0.5～1 g，一日3次。或头孢唑林，静脉滴注，一次1 g，每8小时1次，或头孢呋辛酯口服，0.5 g，每8小时1次，加（或不加）阿奇霉素或克拉霉素，剂量同慢性支气管炎加重。疗程7～10日。

◆ 次选药物：多西环素，口服，一次0.1 g，每12小时1次。或左氧氟沙星；或莫西沙星；剂量同慢性支气管炎加重，疗程7～10日。

◆ 说明：肺炎链球菌对青霉素中介水平者，仍可选用青霉素，但需提高剂量，240万U，每4或6小时1次。我国肺炎链球菌对大环内酯类耐药率高，故不宜单独应用大环内酯类，但对非典型病原菌仍有良好疗效。

（2）老年人或有基础疾病者

◆ 可能病原菌：肺炎链球菌、流感杆菌，需氧革兰阴性杆菌，金黄色葡萄球菌，卡他莫拉菌等。

◆ 首选药物：头孢呋辛，静脉滴注，一次1.5 g，每8小时1次，或阿莫西林克拉维酸，口服或静脉滴注。或氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，一次1.5 g，每8小时1次，加（或不加）阿奇霉素或克拉霉素（剂量同青壮年者）；对社区获得性肺炎疗程7～10日。

◆ 次选药物：左氧氟沙星，静脉滴注，一次0.2 g，每12小时1次，或莫西沙星，口服，或静脉滴注，0.4 g，一日1次。

（3）需住院、但不需住重症监护病房

的患者

◆ 可能病原菌：肺炎链球菌、流感杆菌，包括厌氧菌的混合感染、需氧革兰阴性杆菌、金黄色葡萄球菌、肺炎支原体、肺炎衣原体等。

◆ 首选药物：二代头孢菌素，如头孢呋辛，静脉滴注。或阿莫西林克拉维酸，静脉滴注。或氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，加大环内酯类，静脉滴注。或莫西沙星，静脉滴注。剂量均同青壮年者。

◆ 次选药物：头孢曲松，静脉滴注，1～2 g，一日 1 次，或头孢噻肟，静脉滴注，一次 2 g，每 8 小时 1 次，加大环内酯类，静脉滴注。

◆ 说明：肺炎链球菌等一般细菌感染，疗程为 7～10 日，或退热后 72 小时停药；对金黄色葡萄球菌、铜绿假单胞菌、克雷伯菌属或厌氧菌感染，疗程应大于 2 周。肺炎支原体或肺炎衣原体感染，疗程 10～14 日。军团菌感染，疗程 14～21 日。

（4）需住重症监护病房的重症患者

◆ 可能病原菌：肺炎链球菌，需氧革兰阴性杆菌，流感杆菌，铜绿假单胞菌，金黄色葡萄球菌，军团菌，肺炎支原体等。

◆ 首选药物：无铜绿假单胞菌感染危险因素者，头孢曲松或头孢噻肟，静脉滴注，加大环内酯类，静脉滴注。或莫西沙星，静脉滴注，加阿米卡星，静脉滴注，一次 0.4～0.6 g，一日 1 次。或阿莫西林克拉维酸，或氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，加大环内酯类，静脉滴注。或厄他培南，静脉滴注，一次 1 g，一日 1 次，加大环内酯类。疗程 7～14 日。

◆ 次选药物：有铜绿假单胞菌危险因素者：头孢他啶，静脉滴注，2.0 g，每 8 小时 1 次；或头孢吡肟，静脉滴注，一次 2 g，每 12 小时 1 次；或哌拉西林唑巴坦，静脉滴注，一次 4.5 g，每 8 小时 1 次；或头孢哌酮舒巴坦，静脉滴注，一次 2 g，每 8 小时 1 次；或亚胺培南，静脉滴注，一次 0.5 g，每 8 小时 1 次；或美罗培南，静脉滴注，一次 1 g，每 8 小时 1 次；均加大环内酯类，静脉滴注。或喹诺酮类，静脉滴注，加氨基糖苷类，静脉滴注。疗程 14～21 日。

◆ 说明：铜绿假单胞菌感染的危险因素有：患结构性肺疾病如支气管扩张、弥漫性泛细支气管炎，近期曾用广谱抗生素，近期曾住院，长期住康复护理院等。

9.2.2.4 医院获得性肺炎

医院获得性肺炎（hospital-acquired pneumonia）的治疗如下。

（1）早发性无多重耐药病原菌危险因素者（起病于住院 5 日以内）

◆ 可能病原菌：肺炎链球菌，流感杆菌，甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌（MSSA），抗生素敏感肠道埃希菌（大肠埃希菌、肺炎克雷伯杆菌、变形杆菌、沙雷杆菌、肠杆菌属等）。

◆ 首选药物：头孢曲松或头孢噻肟，或氨苄西林舒巴坦，或厄他培南，或莫西沙星。剂量同社区获得性肺炎需住重症监护病房的重症患者部分。

◆ 次选药物：莫西沙星或左氧氟沙星。

◆ 说明：耐多药危险因素有：近 3 个月曾用广谱抗生素，近 3 个月曾住院≥ 5 日，所住社区或医院有高发耐药菌，常住康复护理院者，在门诊慢性透析者，患有免疫抑制性疾病或用免疫抑制药治疗者。

（2）晚发性有多重耐药病原菌危险因素者（起病于住院≥ 5 日后）

◆ 可能病原菌：同早发性者以及耐多药病原菌，如铜绿假单胞菌、不动杆菌、产超广谱酶（ESBL）克雷伯杆菌和大肠埃希菌，甲氧西林耐药金黄色葡萄球菌（MRSA）。

◆ 首选药物：头孢他啶，或头孢吡肟，或亚胺培南，或美罗培南，或头孢哌酮舒巴坦，或哌拉西林他唑巴坦加阿米卡星（剂量同社区获得性肺炎需住重症监护病房的患者部分）或环丙沙星加万古霉素，静脉滴注，一次 1 g，每 12 小时 1 次，或加替考拉宁，静脉滴注，首日一次 200～400 mg，每 12 小时 1 次；以后一次 200～400 mg，一日 1 次；或加利奈唑胺，静脉滴注，600 mg，每 12 小时 1 次。疗程 14～21 日。

◆ 次选药物：阿米卡星。或用氟喹诺酮类（左氧氟沙星或环丙沙星，静脉滴注，均一次 200 mg，每 12 小时 1 次）代替。对军团菌感染可用大环内酯类和（或）氟

喹诺酮类。疗程 14 ~ 21 日。

9.2.2.5 肺脓肿

肺脓肿（lung abscess）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：厌氧菌，金黄色葡萄球菌，肺炎链球菌，溶血性链球菌，肠杆菌科细菌。

◆ 首选药物：青霉素（剂量同社区获得性肺炎青壮年，无基础病患者部分）或阿莫西林克拉维酸，静脉滴注，1.2 g，每 6 或 8 小时 1 次。或氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，一次 3 g，每 8 小时 1 次；或头孢呋辛，静脉滴注，剂量同上。均加甲硝唑，静脉滴注，一次 0.5 g，每 8 或 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：头孢曲松，静脉滴注，一次 2 g，一日 1 次。或头孢噻肟，静脉滴注，一次 2 g，每 8 小时 1 次；或莫西沙星，静脉滴注。均加甲硝唑或克林霉素，静脉滴注，一次 0.6 g，每 12 小时 1 次或莫西沙星，静脉滴注。

◆ 说明：如病原菌为肠杆菌科细菌，可加阿米卡星；如病原菌为耐甲氧西林金黄色葡萄球菌，用万古霉素，静脉滴注，一次 1 g，每 12 小时 1 次（或相当剂量的去甲万古霉素）。

9.2.3 消化系统感染及其药物治疗

9.2.3.1 胃肠炎及其药物治疗

胃肠炎（gastroenteritis）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：志贺菌属、沙门菌属、空肠弯曲菌、大肠埃希菌、病毒、寄生虫。

◆ 首选药物：①非感染性腹泻：单纯补液治疗，无使用抗菌药物的指征，多数为自限性。②感染性腹泻：氟喹诺酮类如左氧氟沙星，口服，成人一次 0.1 ~ 0.2g，一日 2 次，或环丙沙星成人一次 0.25g，一日 2 次。严重者给予静脉滴注。

◆ 次选药物：复方磺胺甲噁唑片，一次 2 片，口服，一日 2 次；或小檗碱，一次 0.3 g，口服，一日 3 次。或氨苄西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。重症可用头孢曲松，一次 1 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢噻肟，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 说明：根据药物敏感试验调整治疗方案。

9.2.3.2 弧菌性感染及其药物治疗

（1）霍乱弧菌感染（霍乱）：见 9.1.19。

（2）副溶血弧菌感染

◆ 首选药物：轻症可以自愈。重症用氟喹诺酮类，如左氧氟沙星静脉滴注，一次 0.2 g，每 12 小时 1 次；或多西环素，口服，一次 0.1 g，一日 2 次；或头孢曲松静脉滴注，一次 1 g，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：多西环素，口服，一次 0.1 g，一日 2 次。或双剂量的复方磺胺甲噁唑片或喹诺酮类药物（多西环素首剂加倍）。

9.2.3.3 胆道感染及其药物治疗

◆ 可能病原菌：大肠埃希菌、克雷伯菌属、肠球菌属、葡萄球菌属、拟杆菌属、梭菌属等。

◆ 首选药物：头孢哌酮舒巴坦 1 ~ 2 g 或 1.5 ~ 3 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次；加甲硝唑 0.5 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢曲松 1 ~ 2 g，静脉滴注，一日 1 次；加甲硝唑 0.5 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或莫西沙星 400 mg 静脉滴注，一日 1 次。

◆ 次选药物：哌拉西林他唑巴坦静脉滴注，一次 4.5 g，每 8 小时 1 次。替卡西林克拉维酸，一次 3 g，静脉滴注，每 6 小时 1 次。

◆ 说明：β-内酰胺类过敏者可选氨曲南，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。危重患者可选用亚胺培南西司他汀，静脉滴注，一次 0.5 ~ 1 g，每 8 小时 1 次。

9.2.3.4 自发性细菌性腹膜炎及其药物治疗

自发性细菌性腹膜炎（spontaneous bacterial peritonitis，SBP）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：肠杆菌科、肠球菌属、偶有厌氧菌。

◆ 首选药物：腹水中性粒细胞 > 250×10^6/L，经验性首选头孢哌酮舒巴坦，一次 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。或头孢噻肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12

小时1次。或头孢曲松，静脉滴注，一次1～2g，一日1次。

◆ 次选药物：哌拉西林他唑巴坦，静脉滴注，一次4.5g，每8小时1次。氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，一次1.5g，每8小时1次。

◆ 说明：腹水细菌培养出结果后，立即选择敏感的窄谱抗生素。疗程至少2周。

9.2.3.5 继发性腹膜炎及其药物治疗

继发性腹膜炎（secondary peritonitis）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：肠杆菌科、铜绿假单胞菌、肠球菌属、拟杆菌属。

◆ 首选药物：上消化道穿孔所致患者宜选用二、三代头孢菌素或广谱青霉素类。下消化道穿孔所致者宜选用替卡西林克拉维酸，静脉滴注，一次3.2g，每6小时1次。或哌拉西林他唑巴坦，一次4.5g，静脉滴注，每8小时1次。

◆ 次选药物：重症选用美罗培南，静脉滴注，一次1.0g，一日2～3次。或亚胺培南西司他汀，一次0.5g，静脉滴注，每6～8小时1次。或头孢吡肟，静脉滴注，一次1～2g，每12小时1次；加甲硝唑静脉滴注，0.5g，每12小时1次。

◆ 说明：青霉素类过敏者使用莫西沙星，静脉滴注，一次400g，每日1次，加甲硝唑，静脉滴注，一次0.5g，每12小时1次。

9.2.3.6 持续性非卧床腹膜透析相关腹膜炎及其药物治疗

持续性非卧床腹膜透析相关腹膜炎（continuous ambulatory peritoneal dialysis related peritonitis）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、铜绿假单胞菌、革兰阴性杆菌。

◆ 首选药物：选用去甲万古霉素，静脉滴注，一次15 mg/kg，每12小时1次，加哌拉西林，静脉滴注，一次2～4g，每8小时1次。重度感染可在腹膜透析液中加入抗菌药。

◆ 次选药物：万古霉素，静脉滴注，一次15 mg/kg，每12小时1次，加抗假单胞菌第三代头孢菌素，如头孢他啶，静脉滴注，一次2g，每12小时1次。

◆ 说明：去甲万古霉素要监测血药浓度。

9.2.3.7 急性坏死性胰腺炎并发感染及其药物治疗

急性坏死性胰腺炎并发感染（complicated infection with acute necrotizing pancreatitis）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：肠杆菌科、肠球菌属、厌氧菌、表皮葡萄球菌、金黄色葡萄球菌、念珠菌属。

◆ 首选药物：首选替卡西林克拉维酸钾，静脉滴注，一次3.2g，每6小时1次。或哌拉西林三唑巴坦，静脉滴注，一次4.5g，每8小时1次。或头孢哌酮舒巴坦，静脉滴注，1～2g，每12小时1次。

◆ 次选药物：可选亚胺培南西司他汀，静脉滴注，一次0.5g，每8～12小时1次。或美罗培南，静脉滴注，一次1g，每8～12小时1次。或氟喹诺酮类，如莫西沙星，静脉滴注，一次0.4g，一日1次，

9.2.4 心血管系统感染的药物治疗

本处主要介绍感染性心内膜炎（infective endocarditis）及其药物治疗。

（1）初始经验治疗：常见为病原菌有草绿色链球菌、肠球菌属、葡萄球菌属、念珠菌属、需氧革兰阴性杆菌等感染。

◆ 首选药物：首选苯唑西林，静脉滴注，一次1～2g，每4小时1次，加庆大霉素，静脉滴注，一次80 mg，每8小时1次。或首选青霉素静脉滴注，一次400万U，每6小时1次。或阿莫西林克拉维酸，静脉滴注，一次1.2g，每8小时1次。或氨苄西林，一次2～3g，每6小时1次。加阿米卡星，静脉滴注，一次0.4g，一日1次。疗程一般4～6周。

◆ 次选药物：若有心脏修补术或者青霉素过敏，或者怀疑为耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌感染时，可用万古霉素，静脉滴注，15 mg/kg，每12小时1次，加利福平，一次0.3g，口服，一日2～3次。

◆ 说明：对于人工心脏瓣膜心内膜炎和真菌性心内膜炎，疗程需要6～8周或更长，以降低复发率。应用庆大霉素和万

古霉素时要监测血药浓度和药物对耳、肾的毒性。

(2) 葡萄球菌属感染

◆ 首选药物：①甲氧西林敏感的葡萄球菌患者首选苯唑西林，一次 1 ~ 2 g，静脉滴注，每 4 小时 1 次，可以联合阿米卡星，静脉滴注，一次 0.4 g，一日 1 次。治疗至少 4 周。若为人工瓣膜性心内膜炎则疗程至少 6 周。②甲氧西林耐药的葡萄球菌患者首选去甲万古霉素（剂量同持续性非卧床腹膜透析相关腹膜炎部分），联合磷霉素钠，静脉滴注，一次 2 ~ 4 g，每 8 小时 1 次。

◆ 次选药物：①甲氧西林敏感的葡萄球菌属患者，如果对青霉素过敏，可用万古霉素，静脉滴注，一次 15 mg/kg，每 12 小时 1 次。②甲氧西林耐药的葡萄球菌属患者，也可以用万古霉素联合利福平，一日 0.6 ~ 0.9 g，分 1 ~ 2 次口服。

(3) 草绿色链球菌感染

◆ 首选药物：①青霉素敏感株患者，青霉素，静脉滴注，一次 400 万 U，每 4 小时 1 次；加（或不加）庆大霉素，静脉滴注，一次 1 mg/kg，每 8 小时 1 次。或头孢曲松，静脉滴注，一次 2 g，一日 1 次。②青霉素相对耐药株患者，万古霉素，静脉滴注，一次 15 mg/kg，每 12 小时 1 次；或去甲万古霉素，静脉滴注，一次 0.8 g，每 12 小时 1 次。对青霉素高度耐药时可用万古霉素；或替考拉宁，静脉滴注，一次 0.2 ~ 0.4 g，一日 1 次，加庆大霉素（剂量同前）。

◆ 次选药物：①青霉素敏感株患者次选是青霉素，静脉滴注，一次 200 万 ~ 400 万 U，每 6 小时 1 次。加阿米卡星，静脉滴注，一次 0.4 g，一日 1 次。②对青霉素过敏者可用万古霉素，静脉滴注，一次 15 mg/kg，每 12 小时 1 次。

◆ 说明：单独应用青霉素或万古霉素治疗完全敏感的链球菌性心内膜炎应持续 4 周。治疗人工瓣膜性心内膜炎至少用药 6 周。对青霉素、庆大霉素和万古霉素均耐药者选用亚胺培南西司他汀，静脉滴注，一次 0.5 g，每 8 小时 1 次，加氨苄西林，静脉滴注，一次 2 ~ 3 g，每 6 小时 1 次。治疗更耐药的病原菌用 4 ~ 6 周。

(4) 肠球菌属感染

◆ 首选药物：青霉素，1 800 万 ~ 3 000 万 U，分 6 次静脉滴注或 24 小时持续静脉滴注；联合庆大霉素，一次 1 mg/kg，每 8 小时 1 次。或氨苄西林，静脉滴注，一次 2 g，每 4 小时 1 次，联合庆大霉素，一次 1 mg/kg，每 8 小时 1 次。

◆ 次选药物：万古霉素，静脉滴注，一次 15 mg/kg，每 12 小时 1 次。或去甲万古霉素，静脉滴注，一次 0.8 g，每 12 小时 1 次；联合庆大霉素，静脉滴注，一次 1 mg/kg，每 8 小时 1 次（仅用于对 β - 内酰胺酶类过敏者）。利奈唑胺，静脉滴注，一次 0.6 g，每 12 小时 1 次，疗程 2 ~ 4 周。

◆ 说明：头孢菌素不推荐作为青霉素过敏者的替代药物，因为其对肠球菌的作用较差。利奈唑胺的使用要严格掌握适应证，仅限于治疗 MRSA 和耐万古霉素的屎肠球菌。

(5) 需氧革兰阴性杆菌感染

◆ 首选药物：哌拉西林或阿莫西林克拉维酸，静脉滴注，一次 1.2 g，每 6 小时 1 次。联合氨基糖苷类。

◆ 次选药物：第三代头孢菌素，或 β - 内酰胺类与 β - 内酰胺酶抑制药复方制剂联合氨基糖苷类抗生素。

(6) 念珠菌属感染

◆ 首选药物：两性霉素 B，静脉滴注，一次 0.6 mg/kg，一日 1 次。1 周后，一次 0.8 mg/kg，口服，隔日 1 次，至手术后 6 ~ 8 周。联合氟胞嘧啶，一日 100 ~ 150 mg/kg，分 4 次口服，或分 2 次静脉滴注。

◆ 说明：肾功能损害者剂量宜减少。

9.2.5 血液系统感染的药物治疗

9.2.5.1 社区获得性败血症及其药物治疗

社区获得性败血症（community-aquired septicemia）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：大肠埃希菌、葡萄球菌属等。

◆ 首选药物：广谱的抗假单胞菌青霉素类，如哌拉西林他唑巴坦，静脉滴注，一次 4.5 g，每 8 小时 1 次；或替卡西林克拉维酸钾，静脉滴注，一次 3 g，每 6

小时1次。或广谱的头孢菌素类，如头孢他啶，静脉滴注，一次2g，每12小时1次。或头孢噻肟，静脉滴注，一次2g，每12小时1次。如为疑似假单胞菌感染或为严重败血症或患者近期出院，可加用氨基糖苷类药物。

◆ 次选药物：如疑似耐甲氧西林金黄色葡萄球菌感染时，可加用万古霉素，静脉滴注，一次15 mg/kg，每12小时1次。或替考拉宁，静脉滴注，第1日0.4g，次日起减半，一次0.2g，一日1次。如疑似厌氧菌感染可应用广谱头孢菌素，加甲硝唑，静脉滴注，一次0.5g，每12小时1次。

◆ 说明：去甲万古霉素要监测血药浓度。

9.2.5.2 医院获得性败血症及其药物治疗

医院获得性败血症（hospital-aquired septicemia）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：葡萄球菌属、肠球菌属、大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌、阴沟肠杆菌、变形杆菌属、铜绿假单胞菌、不动杆菌属、厌氧菌、真菌。

◆ 首选药物：广谱抗假单胞菌的β-内酰胺类抗菌药，如头孢他啶，一次2g，静脉滴注，每12小时或8小时1次。哌拉西林他唑巴坦，一次4.5g，静脉滴注，每8小时1次。替卡西林克拉维酸钾，一次3.2g，静脉滴注，每6小时1次。或亚胺培南西司他汀，一次0.5g，静脉滴注，每8小时或12小时1次。或美罗培南，一次0.5g，静脉滴注，每8小时或12小时1次。

◆ 次选药物：如疑似假单胞感染或多重耐药菌或严重脓血症等，可加用氨基糖苷类药物，如疑似耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌感染，可加用万古霉素，一次15 mg/kg，静脉滴注，每12小时1次。或替考拉宁，一次0.4g，静脉滴注，一日1次，次日起减半，一次0.2g，一日1次。如疑似厌氧菌感染，可应用广谱头孢菌素类，加甲硝唑一次0.5g，静脉滴注，每12小时1次。

◆ 说明：真菌性败血症应给予相应的抗真菌药物治疗。

9.2.5.3 血管导管类败血症及其药物治疗

◆ 可能病原菌：金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌、凝固酶阴性葡萄球菌或白色念珠菌。

◆ 首选药物：万古霉素，一次15 mg/kg，静脉滴注，每12小时1次。或替考拉宁，一次0.4g，静脉滴注，一日1次，次日起减半，一次0.2g，一日1次。

◆ 次选药物：如怀疑为革兰阴性菌脓毒病，特别是免疫功能受损者，选用广谱抗假单胞菌的β-内酰胺类抗菌药。如怀疑为大肠埃希菌，可选用第三代头孢菌素。

◆ 说明：如怀疑为金黄色葡萄球菌、假单胞菌或念珠菌导致的感染，应考虑除去血管内导管。去甲万古霉素要监测血药浓度。

9.2.6 骨关节肌肉感染的药物治疗

9.2.6.1 骨髓炎及其药物治疗

骨髓炎（osteomyelitis）的治疗如下。

（1）金黄色葡萄球菌感染

◆ 首选药物：青霉素，一次240万~320万U；或阿莫西林克拉维酸，静脉滴注，一次1.2~2.4g，每8小时1次。

◆ 次选药物：万古霉素，静脉滴注，一次0.5g，每8或每12小时1次。利奈唑胺，静脉滴注，一次600 mg，每12小时1次。

◆ 说明：急性者疗程4~5周，慢性者疗程至少12周。如有死骨应手术去除。

①甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌（MSAA）感染

◆ 首选药物：青霉素，剂量同金黄色葡萄球菌感染。

◆ 次选药物：阿莫西林克拉维酸，剂量同金黄色葡萄球菌感染。

②耐甲氧西林金黄色葡萄球菌（MRSA）感染

◆ 首选药物：万古霉素，静脉滴注，一次0.5g，每8小时1次。或替考拉宁，静脉滴注，一次0.4g，一日1次。骨髓炎的疗程推荐为3周。

◆ 次选药物：利奈唑胺，静脉滴注，一次0.6g，每12小时1次。或加用夫西地酸或利福平。

(2) 链球菌感染

◆ 首选药物：青霉素，剂量同金黄色葡萄球菌感染。

◆ 次选药物：对青霉素过敏者可选用克林霉素，静脉滴注，一次 0.6 ~ 0.9 g，每 8 或 12 小时 1 次。

9.2.6.2 化脓性关节炎及其药物治疗

化脓性关节炎 (sappurant arthritis) 的治疗如下。

(1) 甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌 (MSSA) 感染

◆ 首选药物：同 MSSA 感染骨髓炎。

◆ 次选药物：同 MSSA 感染骨髓炎。

◆ 说明：关节腔内有异物要手术清除。

(2) 耐甲氧西林金黄色葡萄球菌 (MRSA) 感染

◆ 首选药物：同 MRSA 感染骨髓炎。

◆ 次选药物：同 MRSA 感染骨髓炎。

◆ 说明：脓液多时要引流并清除异物

9.2.6.3 肌间脓肿及其药物治疗

肌间脓肿 (intramuscular abscess) 的治疗如下。

(1) 甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌 (MSSA) 感染

◆ 首选药物：同 MSSA 感染骨髓炎。

◆ 次选药物：同 MSSA 感染骨髓炎。

◆ 说明：首先要引流。

(2) 耐甲氧西林金黄色葡萄球菌 (MRSA) 感染

◆ 首选药物：同 MRSA 感染骨髓炎。

◆ 次选药物：同 MRSA 感染骨髓炎。

◆ 说明：首先要引流。

9.2.7 泌尿生殖系统感染的药物治疗

9.2.7.1 急性肾盂肾炎及其药物治疗

急性肾盂肾炎 (acute pyelonephritis) 的治疗如下。

◆ 可能病原菌：大肠埃希菌或其他肠杆菌科。

◆ 首选药物：阿莫西林克拉维酸，静脉滴注，一次 1.2 g，每 8 小时或 12 小时 1 次。或氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，一次 1.5 g，每 8 小时或 12 小时 1 次，疗程 10 ~ 14 日，有并发症的适当延长。

◆ 次选药物：头孢唑林，静脉滴注，一次 2 g，每 12 小时 1 次。或头孢呋辛，静脉滴注，一次 1.5 g，每 12 小时 1 次。或环丙沙星，静脉滴注，一次 0.4 g，每 12 小时 1 次。或左氧氟沙星，静脉滴注，一次 0.5 g，一日 1 次。

◆ 说明：国内大肠埃希菌对氟喹诺酮类耐药率高，尽量少用，最好做敏感试验后再用。

9.2.7.2 慢性肾盂肾炎及其药物治疗

慢性肾盂肾炎 (chronic pyelonephritis) 的治疗如下。

◆ 可能病原菌：大肠埃希菌或其他肠杆菌科。

◆ 首选药物：同急性肾盂肾炎，可以先用静脉滴注，热退后改为口服。疗程可延长至 14 ~ 28 日；个别反复发作者可用 4 ~ 6 周。

◆ 次选药物：同急性肾盂肾炎。

◆ 说明：多喝水使尿增加，如有积水需找出引起积水的原因，在解除病因（如输尿管狭窄等）的同时用抗感染药物。

9.2.7.3 急或慢性肾盂肾炎及其药物治疗

急或慢性肾盂肾炎 (acute or chronic pyelonephritis) 的治疗如下。

◆ 可能病原菌：肠球菌。

◆ 首选药物：磷霉素钠，口服，一次 4 g，一日 2 次。或替考拉宁，静脉滴注，一次 400 mg，一日 1 次。

◆ 次选药物：利奈唑胺，口服或静脉滴注，一次 600 mg，每 12 小时 1 次。

9.2.7.4 下尿路感染及其药物治疗

下尿路感染 (lower urinary tract infection) 的治疗如下。

(1) 大肠埃希菌或其他肠杆菌科、肠球菌感染

◆ 首选药物：同急或慢性肾盂肾炎。

◆ 次选药物：用药同上。亦可用头孢氨苄、头孢拉定、头孢克洛，口服，剂量均为一次 0.25 g，一日 3 ~ 4 次。

(2) 大肠埃希菌或肠球菌感染

◆ 首选药物：复方磺胺甲噁唑片，口服，一次 2 片，一日 2 次。环丙沙星，静

脉滴注，一次 0.4 g，每 12 小时 1 次。或左氧氟沙星，口服，一次 0.5 g，一日 1 次。

9.2.7.5 非淋病性尿道炎和非特异性生殖道感染及其药物治疗

非淋病性尿道炎（non-gonococcal urethritis）和非特异性生殖道感染（non-specific genital infection）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：衣原体或毛滴虫。

◆ 首选药物：多西环素，口服，一次 100 mg，一日 2 次，疗程 7 日。或阿奇霉素，口服，一次 0.5 g，一日 1 次，连用 3 日；或阿奇霉素，首日口服 0.5 g，次日起一日 1 次 0.25 g，连服 4 日。对衣原体感染亦可选用阿奇霉素单剂量 1 g 顿服。

◆ 次选药物：对复发性或迁延性者用甲硝唑，单剂量 2 g 顿服，加红霉素，口服，一次 0.5g，一日 4 次，疗程 7 日。

◆ 说明：性伴侣应同时治疗。

9.2.7.6 盆腔炎性疾病及其药物治疗

盆腔炎常为需养菌、厌氧菌和衣原体的混合感染，常见病原菌有乙型溶血性链球菌、金黄色葡萄球菌、大肠埃希菌、淋病奈瑟菌、衣原体等。其药物治疗应根据病原菌的药敏试验选用抗菌药，但患者在获得药敏结果之前需给予经验性治疗，依据疾病严重程度选择可能方式和抗菌药。用药的足量、足疗程十分重要。

9.2.7.6.1 经验性治疗

（1）非静脉药物治疗（或门诊治疗）：若患者一般情况好，症状轻，能耐受口服抗生素，并有随访条件，可门诊治疗。下列药物可覆盖盆腔炎常见的病原体。

◆ 首选药物：氧氟沙星，口服，一次 400 mg，一日 2 次（或左氧氟沙星，口服，一次 500 mg，一日 1 次），同时加用甲硝唑，口服，一次 500 mg，一日 2 次，连服共 14 日。或莫西沙星，口服，一次 400 mg，一日 1 次，连服共 14 日。

◆ 次选药物：头孢曲松，肌内注射，单次给药 250 mg（或头孢西丁 2 g，肌内注射），加丙磺舒 1 g，口服，均单次给药，或其他三代头孢菌素类药物，如头孢唑肟、头孢噻肟等，加用多西环素，口服，一次 100 mg，12 小时 1 次；或米诺环素 100 mg，口服，12 小时 1 次；或阿奇霉素，口服，一次 0.5 g，12 小时 1 次，共 14 日，或甲硝唑，口服，一次 500 mg，一日 2 次。其中头孢西丁可以更好地覆盖厌氧菌，而头孢曲松可以更好地覆盖淋病奈瑟菌。

◆ 说明：首选药物替代药物：阿莫西林克拉维酸钾加用多西环素可以获得短期的临床效果，但胃肠道反应可能会影响该方案的依从性。口服药物治疗持续 72 小时症状无明显改善者，应重新确认诊断并调整治疗方案。

（2）静脉药物治疗（或住院治疗）：若患者一般情况差，病情严重应住院治疗。

◆ 首选药物：头孢替坦，静脉滴注，一次 2 g，12 小时 1 次；或头孢西丁，静脉滴注，一次 2 g，6 小时 1 次。加用多西环素，口服，100 mg，12 小时 1 次，或米诺环素，口服，100 mg，12 小时 1 次；或阿奇霉素，静脉滴注或口服，一次 0.5 g，12 小时 1 次。但需特别注意的是：①其他二代或三代头孢菌素（如头孢唑肟、头孢噻肟和头孢曲松）也可能对盆腔炎性疾病有效，并有可能代替头孢替坦和头孢西丁，但后两者的抗厌氧菌效果更强。②对输卵管、卵巢脓肿的患者，通常在应用多西环素（或米诺环素或阿奇霉素）的基础上，加用克林霉素或甲硝唑，可更有效地对抗厌氧菌。③对输卵管、卵巢脓肿的患者，应用多西环素（或米诺环素或阿奇霉素）加甲硝唑或多西环素（或米诺环素或阿奇霉素）加克林霉素比单纯应用多西环素（或米诺环素或阿奇霉素）对治疗厌氧菌感染更有效。④临床症状改善后，继续静脉给药至少 24 小时，然后转为口服药物治疗，共持续 14 日。

◆ 次选药物：克林霉素 900 mg，静脉滴注，8 小时 1 次。加用硫酸庆大霉素负荷剂量（2 mg/kg），静脉滴注或肌内注射，维持剂量为 1.5 mg/kg，8 小时 1 次。也可采用每日 1 次给药。应注意的是：①临床症状改善后，继续静脉给药至少 24 小时，继续口服克林霉素 450 mg，一日 1 次，共 14 日。②注意硫酸庆大霉素的不良反应。

◆ 说明：首选药物的替代药物：①氧

氟沙星，静脉滴注，400 mg，12 小时 1 次，加用甲硝唑，静脉滴注，一次 500 mg，8 小时 1 次；或左氧氟沙星，静脉滴注，12 小时 1 次，加用甲硝唑 500 mg，静脉滴注，8 小时 1 次；或莫西沙星 400 mg，静脉滴注，一次 500 mg，12 小时 1 次。②氨苄西林舒巴坦钠，静脉滴注，1 次 3 g，6 小时 1 次，加用多西环素，口服，100 mg，12 小时 1 次，或米诺环素，口服，一次 100 mg，12 小时 1 次；或阿奇霉素，静脉滴注或口服，一次 0.5 g，一日 1 次。

9.2.7.6.2 针对敏感菌性治疗

(1) 金黄色葡萄球菌和凝固酶阴性葡萄球菌感染

◆ 首选药物：①甲氧西林敏感菌株：苯唑西林，静脉滴注，一次 1 ~ 2 g，每 4 小时 1 次。或氯唑西林，静脉滴注，一次 1 ~ 2 g，每 8 小时 1 次。②甲氧西林耐药菌株：去甲万古霉素，静脉滴注，一次 15 mg/kg，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：①甲氧西林敏感菌株：头孢唑啉，静脉滴注，一次 1 g，每 8 小时 1 次。或头孢呋辛，静脉滴注，一次 1.5 g，每 8 小时 1 次。或克林霉素，静脉滴注，一次 0.6 g，每 12 小时 1 次。②甲氧西林耐药菌株：替考拉宁，静脉滴注，首日一次 0.4 g，次日起减半，一次 0.2 g，一日 1 次。利奈唑胺，静脉滴注，一次 0.6 g，每 12 小时 1 次。或利福平，口服，一次 0.6 ~ 0.9 g，分 1 ~ 2 次服用。

(2) 肠球菌属感染

◆ 首选药物：氨苄西林，一次 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。或青霉素，加氨基糖苷类。

◆ 次选药物：去甲万古霉素，一次 15 mg/kg，静脉滴注，每 12 小时 1 次；或克林霉素，一次 0.6 ~ 0.9 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。加多西环素，一次 100 mg，口服，一日 2 次，连用 14 日。

(3) 溶血性链球菌感染

◆ 首选药物：青霉素，一次 240 万 U，静脉滴注，每 4 小时或 6 小时 1 次。或氨苄西林，一次 2 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。

◆ 次选药物：头孢唑啉，一次 1 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。或头孢呋辛，一次 1.5 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。或克林霉素，一次 0.6 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

(4) 大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌等感染

◆ 首选药物：①非产超广谱内酰胺酶菌株：第二、三代头孢菌素或头孢吡肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。②产超广谱内酰胺酶菌株：哌拉西林他唑巴坦，一次 4.5 g，静脉滴注，每 8 小时 1 次。或头孢哌酮舒巴坦，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：氟喹诺酮类或氨基糖苷类抗生素。

(5) 肠杆菌属、柠檬酸杆菌属感染

◆ 首选药物：头孢吡肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或氟喹诺酮类。

◆ 次选药物：氨基糖苷类抗生素或头孢他啶，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

(6) 沙雷菌属感染

◆ 首选药物：头孢他啶，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或其他第三代头孢菌素。

◆ 次选药物：头孢吡肟，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或头孢哌舒巴坦，一次 1.5 ~ 3 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。或氨基糖苷类。

(7) 不动杆菌属感染

◆ 首选药物：氨苄西林舒巴坦，静脉滴注，一次 1.5 g，每 8 小时 1 次。或头孢哌酮舒巴坦，一次 2 g，静脉滴注，每 12 小时 1 次。

◆ 次选药物：氨基糖苷类抗生素。或头孢吡肟，静脉滴注，一次 2 g，每 12 小时 1 次。或碳青霉烯类。

(8) 脆弱拟杆菌感染

◆ 首选药物：甲硝唑，静脉滴注，一次 0.5 g，每 12 小时 1 次。或替硝唑，口服，一日 2 g，连服 2 日。

◆ 次选药物：氯霉素，静脉滴注，一次 1 g，每 12 小时 1 次。或克林霉素，静脉滴注，一次 0.6 g，每 12 小时 1 次。

(9) 淋病奈瑟菌感染

◆ 首选药物：头孢曲松，静脉滴注，一次 1 g，每 12 小时 1 次。或大观霉素。

◆ 次选药物：多西环素，口服，一次0.1 g，一日2次。

(10) 沙眼衣原体感染

◆ 首选药物：多西环素，口服，一次0.1 g，一日2次，口服。或大环内酯类抗生素。

◆ 次选药物：左氧氟沙星，静脉滴注，一次0.2 g，每12小时1次。或莫西沙星，静脉滴注，一次0.4 g，一日1次。

9.2.8 感染药物预防

9.2.8.1 新生儿链球菌病的预防

新生儿链球菌病（neonatal streptococcal infection）的治疗如下。

◆ 可能病原菌：B族链球菌。

◆ 首选药物：分娩期预防用药，青霉素，静脉滴注，首剂500万U，然后250万U，每4小时或6小时1次。或氨苄西林，静脉滴注，首剂2 g，然后1 g，每4小时或6小时1次。

◆ 次选药物：青霉素过敏者，克林霉素，静脉滴注，一次600 mg，每8小时1次，或红霉素，静脉滴注，一次500 mg，每8小时1次；非高危过敏反应者可用头孢唑啉，静脉滴注，首剂2 g，然后1 g，每8小时1次。

◆ 说明：以下情况需治疗：①妊娠35～37周阴道拭子培养B族链球菌（GBS）阳性；②既往分娩婴儿有侵入性GBS感染；③羊膜早破≥18小时；④分娩时体温≥38℃。

9.2.8.2 脾切除后菌血症的预防

◆ 可能病原菌：肺炎链球菌（90%），脑膜炎球菌，B型流感杆菌。

◆ 首选药物：5岁以内患镰状细胞贫血和珠蛋白生成障碍性贫血的无脾小儿，阿莫西林，口服，20 mg/kg，一日1次。或青霉素V钾，口服，一次125 mg，一日2次，服至5岁。5岁以上脾切除后用青霉素V钾，口服，一次250 mg，一日2次，至少1年。

◆ 次选药物：青霉素过敏者，复方磺胺甲噁唑片，口服，以其中甲氧苄啶含量8～12 mg计，分2次服。或克拉霉素，口服，7.5 mg/kg，每12小时1次。

◆ 说明：定期进行免疫接种，确保按时使用肺炎球菌疫苗、流感杆菌疫苗及四价脑膜炎球菌疫苗。

9.2.8.3 细菌性心内膜炎

瓣膜病或先天性心脏病患者须行牙科有创操作或呼吸道有创操作或泌尿道有创操作时。

◆ 可能病原菌：草绿链球菌，其他链球菌，肠球菌，葡萄球菌。

◆ 首选药物：麻醉诱导时阿莫西林静脉给药1 g，6小时后口服500 mg；或麻醉诱导时阿莫西林静脉给药1 g＋阿米卡星静脉给0.4 g，6小时后阿莫西林口服500 mg。

◆ 次选药物：青霉素过敏者，操作前万古霉素静脉给药1 g（用100分钟滴完）；或操作前替考拉宁静脉给药400 mg；或操作前克林霉素静脉给药300 mg，6小时后静脉给药150 mg。

9.2.8.4 风湿热复发

◆ 可能病原菌：A族链球菌。

◆ 首选药物：阿莫西林口服250～500 mg，一日2次，服用数月或更长。

◆ 次选药物：青霉素过敏者，红霉素口服250 mg，一日2次，服用数月或更长。

◆ 说明：不能坚持长疗程者，可定期做咽拭子培养，发现A族链球时按急性链球菌咽炎给予青霉素类或红霉素类治疗1个疗程。

9.2.8.5 接触流行性脑膜炎患者后

◆ 可能病原菌：脑膜炎球菌。

◆ 首先药物：球丙沙星口服400 mg，单剂量；2～5岁儿童125 mg，5～12岁儿童250 mg；或头孢曲松肌内注射250 mg，单剂量，12岁以下儿童125 mg。

9.2.8.6 未免疫或部分免疫者接触百日咳患者后

◆ 可能病原菌：百日咳鲍特菌。

◆ 首选药物：成人或8岁以上儿童红霉素口服250～500 mg，每6小时1次，用7日；2岁以下儿童125 mg，每6小时1次，用7日；2～8岁儿童250 mg，每

6小时1次，用7日。

9.2.8.7 接触白喉患者后

◆ 可能病原菌：白喉棒状杆菌

◆ 首选药物：红霉素口服500 mg，每6小时1次，用7日；2岁以下儿童125 mg，每6小时1次，用7日；2～8岁儿童250 mg，每6小时1次，用7日。

9.2.8.8 性接触或被强暴后的预防

◆ 可能病原菌：淋球菌、沙眼衣原体，梅毒螺旋体。

◆ 首选药物：头孢曲松，肌内注射，一次500 mg，一日1次，加多西环素，口服，一次100 mg，一日2次，服7日。或头孢克肟，口服，一次400 mg，加阿奇霉素，口服，一次1 g；均服1次。

◆ 次选药物：对3个月内的性暴露可行假定性梅毒治疗，苄星青霉素，肌内注射，一次240万U，1次。或头孢曲松，肌内或静脉滴注1 g，一日1次，用8～10日。或多西环素，口服，一次100 mg，一日2次，共14日。

◆ 说明：性暴露后初始检查包括：淋球菌培养，血清梅毒、乙型肝炎、HIV检测；1～2周后复查性传播疾病；若梅毒和HIV血清学阴性，第6、12、24周复查。

9.2.9 手术感染的药物预防

预防性抗菌药物只给予有使用指征的患者，主要是：①Ⅱ类切口（清洁-污染切口或污染切口）中-大型手术，例如进入消化道、呼吸道、女性生殖道的手术；②清洁切口手术但创伤大、时间长、涉及重要器官、一旦感染后果严重者，例如开颅手术，心、大血管手术，门静脉高压症手术；③使用人工材料或人工装置的手术，例如置人人工血管、人工心脏瓣膜、人工关节、心脏起搏器；④有明显感染高危因素，例如高龄（> 65岁）、营养不良、糖尿病、肥胖、免疫功能低下等。

头孢菌素是比较理想的预防用药。Ⅰ类切口手术，第一代头孢菌素是最基本的用药。Ⅱ、Ⅲ类切口手术，革兰阴性杆菌感染机会加大或病情复杂、风险增高时，可选用第二代、第三代头孢菌素。氨基糖苷类抗生素有耳、肾毒性，不是理想的预防用药。一般不用喹诺酮类作为预防药物（可用于经直肠前列腺活检术）。

头孢菌素应在手术开始前30～60分钟给予；手术时间超过3小时，应追加1个剂量。一般的择期手术，手术结束后无需再用药或用药不应超过24小时。有明显感染高危因素的患者或安放人工植入物者，可适当延长用药时间到手术后48小时，至多到72小时。

各类手术的预防用药，见表9-2。

9.3 抗菌药物

抗菌药物是治疗细菌性感染最主要的手段。根据患者的症状、体征及血、尿常规等实验室检查结果，初步临床诊断为细菌性感染者，以及经病原检查确诊为细菌性感染者方有指征应用抗菌药。

临床诊断为细菌性感染者，应在开始抗菌治疗前，留取相关标本送培养、分离、鉴定及药敏试验（以尽早明确感染病原菌及获知药敏试验结果）。在未获知病原菌及药敏结果前，可根据患者的发病场所、临床表现、基础疾病等推断最可能的病原菌，结合当地细菌耐药状况先给予抗菌药经验治疗；在获知病原检查及药敏试验结果后，根据临床情况调整给药方案。

应依据抗菌药物的抗菌谱，以及药物在人体内的吸收、分布、代谢和排泄等特点，按照其临床适应证选择用药；同时按照患者的生理情况（如老年、新生儿、孕妇、哺乳期妇女）、病理情况（如肝功能减退、肾功能减退、导致免疫功能减退的各种基础疾病）选择用药，并制订合理的给药方案。

通常按各种抗菌药物的常用治疗剂量给药，治疗重症感染（如血流感染、感染性心内膜炎等）和抗菌药物不易到达部位的感染（如中枢神经系统感染等）时，可选用组织通透性强的药物，或加大药物剂量（用最大治疗剂量）。如剂量过小可能导致治疗失败或细菌产生耐药性；剂量过大则可能引起不良反应增多。治疗单纯性下尿路感染时，由于多数抗菌药物的尿药浓度远高于其血药浓度，可应用较小剂量。

表 9-2　各类手术的术前预防应用抗生素的用法

手术种类	最可能引起感染的病原菌	术前预防用药及用法*
心脏手术	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注
血管外科手术	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注
神经外科手术	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢曲松，2 g，静脉滴注
头颈外科手术	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注
经口咽部黏膜切口的大手术	金黄色葡萄球菌，链球菌，口咽部厌氧菌（如消化链球菌）	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注，加甲硝唑 250 ~ 500 mg，静脉滴注
乳房手术	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注
腹外疝外科	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注
一般骨科手术（无植入物）	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注
使用人工植入物的骨科手术（闭合骨折开放复位＋内固定术，脊柱融合术，关节置换术）	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌，革兰阴性杆菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢曲松，2 g，静脉滴注
胸外科手术（食管、肺）	金黄色葡萄球菌，凝固酶阴性葡萄球菌，肺炎链球菌，肠道杆菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢曲松，2 g，静脉滴注
胃、十二指肠、小肠手术	葡萄球菌，链球菌，肠道杆菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢曲松，2 g，静脉滴注
肝、胆、胰手术	葡萄球菌，肠道杆菌，厌氧菌（如脆弱类杆菌）	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢曲松，2 g，静脉滴注
阑尾手术	肠道杆菌，厌氧菌（如脆弱类杆菌）	头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢噻肟，1 ~ 2 g，静脉滴注，加甲硝唑 500mg，静脉滴注
结、直肠手术	肠道杆菌，厌氧菌（如脆弱类杆菌）	头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢噻肟，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢曲松，2 g，静脉滴注。加甲硝唑，500mg，静脉滴注
泌尿外科手术	肠道杆菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注
经腹子宫（不全）切除或附件切除术	葡萄球菌，肠道杆菌，B 族链球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注。头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注
涉及阴道的妇科手术	葡萄球菌，肠道杆菌，B 族链球菌，厌氧菌	头孢呋辛，1.5 g，静脉滴注；头孢曲松，1 ~ 2 g，静脉滴注；头孢噻肟，1 ~ 2 g，静脉滴注。加甲硝唑，500 mg，静脉滴注
剖宫产	葡萄球菌	头孢唑林，1 ~ 2 g，静脉滴注（结扎脐带后给药）

轻症感染并可接受口服给药的患者，应选用口服吸收完全的抗菌药，不需采用静脉或肌内注射给药。如有脓性感染应先行外科治疗（切开引流），再使用抗菌药。重症感染、全身性感染的患者初始治疗应予静脉给药，以确保药效。病情好转能口服时应及时改为口服给药。应根据各种抗菌药物的药动学特点决定一日给药次数，时间依赖性抗菌药（如 β-内酰胺类）消除半衰期短者，应一日多次给药；浓度依赖性抗菌药（如氨基糖苷类、喹诺酮类）可一日剂量 1 次给药，但重症感染者例外。抗菌药物的疗程因不同感染而异，通常宜用至体温正常，症状消退后 72 ~ 96 小时，但血流感染、心内膜炎、化脓性脑膜炎、溶血性链球菌咽峡炎等以及结核病、布氏杆菌病等的疗程需较长。

治疗全身性感染或脏器感染时应避免局部应用抗菌药，因为皮肤或黏膜局部应用抗菌药后，很少被吸收，在感染部位不能达到有效浓度，反易引起过敏反应或导致耐药菌产生。抗菌药的局部应用只限于少数情况，如全身给药后在感染部位难以达到有效治疗浓度时可加用局部给药作为辅助治疗，例如治疗中枢神经系统感染某些药物可加用鞘内给药，包裹性厚壁脓肿脓腔内注入抗菌药，以及眼科感染的局部用药等。某些皮肤表层及口腔、阴道等黏膜的浅表感染亦可采用抗菌药局部应用或外用，但应避免将主要治疗全身性感染的品种局部应用。局部用药宜采用刺激性小，不易吸收，不易致敏和不易导致耐药性产生的杀菌药。青霉素类、头孢菌素类等易产生过敏反应的药物不可局部应用，氨基糖苷类耳毒性药不可局部滴耳。

某些细菌性感染需要联合应用抗菌药物，联合应用的指征为：①病原菌尚未查明的严重感染；②单一抗菌药不能有效控制的重症感染，如感染性心内膜炎；③单一抗菌药不能控制的需氧菌及厌氧菌混合感染（如腹腔感染、盆腔感染），或两种或两种以上病原菌感染；④需长程治疗，但病原菌易对某些抗菌药产生耐药的感染，如结核病；⑤联合用药可减少毒性较大的抗菌药的剂量，如两性霉素 B 与氟胞嘧啶联合治疗隐球菌脑膜炎时前者的剂量可适当减少，从而减少其毒性反应。联合用药通常采用两种具有协同抗菌作用的药物联合，3 种及 3 种以上药物联合仅适用于个别情况（如结核病的治疗）。此外应注意联合用药后药物相互作用和不良反应亦将增多。

近年来，临床上抗菌药物用于预防各种感染极为普遍，但应注意预防性应用抗菌药物需有明确指征，即必须有足够的临床资料证实该药对某种感染具有预防作用。抗菌药物在内科及儿科领域中预防应用应遵循以下原则：①用于预防 1 种或 2 种特定病原菌入侵体内引起的感染可能有效；如目的在于防止任何细菌入侵，则往往无效。②预防在一段时间内发生的感染可能有效；长期预防用药常不能达到目的。③患者基础疾病可以治疗或缓解者，预防用药可能有效；基础疾病不能治愈或缓解者，预防用药应尽量不用或少用。④对普通感冒、麻疹、脊髓灰质炎、水痘等病毒性疾病伴发热的患者，各种原因引起的昏迷、休克、心力衰竭、免疫抑制药等患者，预防用药既缺乏指征，也无效果，并易导致耐药菌感染。

围手术期预防用药目的是预防手术部位感染，包括切口感染和手术所涉及的器官和腔隙感染。应根据手术野有否污染或污染可能，决定是否预防应用抗菌药。下列情况可考虑预防用药：①手术范围大，手术时间长，污染机会增加。②手术涉及重要脏器，一旦发生感染将造成严重后果者。③异物植入手术。④高龄、免疫缺陷患者等高危人群。抗菌药的选用视预防目的而定。为预防术后切口感染，应针对金黄色葡萄球菌选用药物，预防器官-腔隙感染，则需依据手术野污染或可能的污染菌种类选用，例如结肠或直肠手术前应选用对大肠埃希菌和脆弱拟杆菌有效的抗菌药。选用的抗菌药应疗效肯定、安全、使用方便以及价格相对较低的品种。

9.3.1 青霉素类

本类药物包括：①天然窄谱青霉素类，有青霉素、青霉素 V，主要作用于革兰阳性菌、革兰阴性球菌和某些革兰阴性杆菌如嗜血杆菌属；②耐青霉素酶窄谱青霉素

类，包括甲氧西林、苯唑西林、氯唑西林、氟氯西林等，本组青霉素对产β-内酰胺酶葡萄球菌属亦有良好作用；③广谱青霉素类，如氨苄西林、阿莫西林等，此组青霉素主要作用于对青霉素敏感的革兰阳性菌以及部分革兰阴性杆菌如大肠埃希菌、奇异变形杆菌、沙门菌属、志贺菌属和流感嗜血杆菌等；④抗假单胞菌青霉素类，如哌拉西林、替卡西林、阿洛西林、美洛西林等，本组药物对革兰阳性菌的作用较天然青霉素或氨基青霉素为差，但对某些革兰阴性杆菌包括铜绿假单胞菌有抗菌活性；⑤本节还列入了青霉素类与β-内酰胺酶抑制药复方制剂，如阿莫西林克拉维酸、氨苄西林舒巴坦、哌拉西林他唑巴坦等。这类复方制剂对革兰阳性菌、革兰阴性菌以及脆弱拟杆菌等均具有良好抗菌活性。

注意事项：①无论采用何种给药途径，用青霉素类药物或含青霉素类的复方制剂前必须详细询问患者有无青霉素类过敏史、其他药物过敏史及过敏性疾病史，并须先做青霉素皮肤试验；②过敏性休克一旦发生，必须就地抢救，并立即给患者皮下注射肾上腺素，并给予吸氧、应用升压药、肾上腺皮质激素等抗休克治疗；③全身应用大剂量青霉素可引起腱反射增强、肌肉痉挛、抽搐、昏迷等中枢神经系统反应（青霉素脑病），此反应易出现于老年和肾功能减退患者，青霉素不可用于鞘内注射；④青霉素钾盐不可快速静脉滴注及静脉注射；⑤应新鲜配制使用，输注时间不宜超过1小时；⑥溶媒体积不宜超过200 ml。

青霉素[基（基）、保（甲）]

Benzylpenicillin

【适应证】(1) 适用于敏感细菌所致各种感染，如脓肿、菌血症、肺炎和心内膜炎等。(2) 青霉素为以下感染的首选药物：①溶血性链球菌感染，如咽炎、扁桃体炎、猩红热、丹毒、蜂窝织炎和产褥热等；②肺炎链球菌感染如肺炎、中耳炎、脑膜炎和菌血症等；③不产青霉素酶葡萄球菌感染；④炭疽；⑤破伤风、气性坏疽等梭状芽胞杆菌感染；⑥梅毒（包括先天性梅毒）；⑦钩端螺旋体病；⑧回归热；⑨白喉；⑩青霉素与氨基糖苷类药物联合用于治疗草绿色链球菌心内膜炎。(3) 青霉素亦可用于治疗：①流行性脑脊髓膜炎；②放线菌病；③淋病；④樊尚咽峡炎；⑤莱姆病；⑥多杀巴斯德菌感染；⑦鼠咬热；⑧李斯特菌感染；⑨除脆弱拟杆菌以外的许多厌氧菌感染；⑩风湿性心脏病或先天性心脏病患者进行口腔、牙科、胃肠道或泌尿生殖道手术和操作前；⑪可用青霉素预防感染性心内膜炎发生。

【注意事项】(1) 应用前询问药物过敏史并进行青霉素皮肤试验。皮试液为每1 ml含500 U青霉素，皮内注射0.05～0.1 ml，经20分钟后，观察皮试结果，呈阳性反应者禁用。必须使用者经脱敏后应用，应随时做好过敏反应的急救准备。(2) 对一种青霉素过敏者可能对其他青霉素类药物、青霉胺过敏，有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病患者应慎用。(3) 青霉素水溶液在室温不稳定，20 U/ml青霉素溶液30℃放置24小时效价下降56%，青霉烯酸含量增加200倍，因此应用本品须新鲜配制。(4) 大剂量使用时应定期检测电解质。(5) 孕妇及哺乳期妇女用药：动物生殖实验未发现本品引起胎仔损害。但尚未在孕妇进行严格对照试验以除外这类药物对胎儿的不良影响，所以孕妇应仅在确有必要时使用。少量本品从乳汁中分泌，哺乳期妇女用药时宜暂停哺乳。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应：青霉素过敏反应较常见，包括荨麻疹等各类皮疹、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作等和血清病型反应；过敏性休克偶见，一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及使用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。(2) 毒性反应：少见，但静脉滴注大剂量本品或鞘内给药时，可因脑脊液药物浓度过高导致抽搐、肌肉阵挛、昏迷及严重精神症状等（青霉素脑病）。此种反应多见于婴儿、老年人和肾功能不全患者。(3) 赫氏反应和治疗矛盾：用青霉素治疗梅毒、钩端螺旋体病等疾病时可由于病原体死亡致症状加剧，称为赫氏反应；治疗矛盾也见于梅毒患者，系治疗后梅毒病灶

消失过快，而组织修补相对较慢或病灶部位纤维组织收缩，妨碍器官功能所致。(4) 二重感染：可出现耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或念珠菌等二重感染。(5) 应用大剂量青霉素钠可因摄入大量钠盐而导致心力衰竭。

【用法与用量】(1) 肌内注射：每 50 万 U 青霉素钠溶解于 1 ml 灭菌注射用水，超过 50 万 U 则需加灭菌注射用水 2 ml，不应以氯化钠注射液为溶剂。①成人：一日 80 万～200 万 U，分 3～4 次给药；②小儿：肌内注射，按体重 2.5 万 U/kg，每 12 小时给药 1 次。(2) 静脉滴注：①成人一日 200 万～2 000 万 U，分 2～4 次给药。②小儿一日按体重 5 万～20 万 U/kg，分 2～4 次给药。③新生儿（足月产）：一次按体重 5 万 U/kg，肌内注射或静脉滴注给药；出生第 1 周每 12 小时 1 次，1 周以上者每 8 小时 1 次，严重感染每 6 小时 1 次。④早产儿：一次按体重 3 万 U/kg，出生第 1 周每 12 小时 1 次，2～4 周者每 8 小时 1 次；以后每 6 小时 1 次。⑤肾功能减退者：轻、中度肾功能损害者使用常规剂量不需减量，严重肾功能损害者应延长给药间隔或调整剂量。当内生肌酐清除率为每分钟 10～50 ml 时，给药间期自 8 小时延长至 8～12 小时或给药间期不变、剂量减少 25%；内生肌酐清除率小于每分钟 10 ml 时，给药间期延长至 12～18 小时或一次剂量减至正常剂量的 25%～50% 而给药间期不变。⑥静脉滴注时给药速度不能超过每分钟 50 万 U，以免发生中枢神经系统毒性反应。

【制剂与规格】注射用青霉素钠：① 0.12 g(20 万 U)；② 0.24 g(40 万 U)；③ 0.48 g(80 万 U)；④ 0.6 g(100 万 U)；⑤ 0.96 g(160 万 U)；⑥ 2.4 g(400 万 U)。

注射用青霉素钾：① 0.125 g（20 万 U）；② 0.25 g（40 万 U）；③ 0.5 g（80 万 U）；④ 0.625 g（100 万 U）。

普鲁卡因青霉素 [保（乙）]

Procaine Benzylpenicillin

【适应证】(1) 由于普鲁卡因青霉素血药浓度较低，故其应用仅限于青霉素高度敏感病原体所致的轻、中度感染，如 A 组链球菌所致的扁桃体炎、猩红热、丹毒、肺炎链球菌肺炎、青霉素敏感金黄色葡萄球菌所致疖、痈及樊尚咽峡炎等。(2) 可用于治疗钩端螺旋体病、回归热和早期梅毒。

【注意事项】(1) 应用前需详细询问药物过敏史并进行青霉素、普鲁卡因皮肤试验。(2) 对一种青霉素过敏者可能对其他青霉素类药物、青霉胺过敏。有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病患者应慎用。(3) 孕妇及哺乳期妇女用药：见青霉素。(4) 应用时须新鲜配制，见青霉素的注意事项 (3)。

【禁忌证】(1) 有青霉素类药物或普鲁卡因过敏史者禁用。(2) 青霉素或普鲁卡因皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】见青霉素不良反应的 (1)、(3)、(4)。

【用法与用量】供肌内注射，临用前加适量灭菌注射用水使成混悬液，一次 40 万～80 万 U，一日 1～2 次。

【制剂与规格】注射用普鲁卡因青霉素：① 40 万 U [普鲁卡因青霉素 30 万 U，青霉素钠（钾）10 万 U]；② 80 万 U[普鲁卡因青霉素 60 万 U，青霉素钠（钾）20 万 U]。

苄星青霉素 [保（乙）]

Benzathine Benzylpenicillin

【适应证】用于预防风湿热复发和控制链球菌感染的流行。

【注意事项】见青霉素注意事项的 (1)、(2)、(3)、(5)。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史者或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应：见青霉素。(2) 二重感染：见青霉素。

【用法与用量】临用前加适量灭菌注射用水使成混悬液。肌内注射：成人，一次 60 万～120 万 U，2～4 周 1 次；小儿，一次 30 万～60 万 U，2～4 周 1 次。

【制剂与规格】注射用苄星青霉素：① 30 万 U；② 60 万 U；③ 120 万 U。

青霉素 V [保（甲）]

Phenoxymethylpenicillin

【适应证】(1) 青霉素敏感菌株所致

的轻、中度感染，包括链球菌所致的扁桃体炎、咽喉炎、猩红热、丹毒等。(2) 肺炎球菌所致的支气管炎、肺炎、中耳炎、鼻窦炎及敏感葡萄球菌所致的皮肤软组织感染等。(3) 螺旋体感染和作为风湿热复发和感染性心内膜炎的预防用药。

【注意事项】(1) 患者一次开始服用前，必须先进行青霉素皮试。(2) 对头孢菌素类药物过敏者及有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病史者慎用。(3) 本品与其他青霉素类药物之间有交叉过敏性。若有过敏反应产生，则应立即停用，并采取相应措施。(4) 肾功能减退者应根据血浆肌酐清除率调整剂量或给药间期。(5) 治疗链球菌感染时疗程需 10 日，治疗结束后宜做细菌培养，以确定链球菌是否已清除。(6) 对怀疑为伴梅毒损害之淋病患者，在使用前应进行暗视野检查，并至少在 4 个月内，每月接受血清试验 1 次。(7) 长期或大剂量服用者，应定期检查肝、肾、造血系统功能和检测血清钾或钠。(8) 对孕妇和哺乳期妇女用药：见青霉素。(9) 老年用药：老年患者应根据肾功能情况调整用药剂量或用药间期。

【禁忌证】青霉素皮试阳性反应者、对本品及其他青霉素类药物过敏者及传染性单核细胞增多症患者禁用。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、上腹部不适、腹泻等胃肠道反应及黑毛舌。(2) 过敏反应：皮疹（尤其易发生于传染性单核细胞增多症者）、荨麻疹及其他血清病样反应、喉水肿、药物热和嗜酸性粒细胞增多等。(3) 二重感染：长期或大量服用本品可致耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白色念珠菌感染（舌苔呈棕色甚至黑色）。(4) 少见溶血性贫血、ALT 及 AST 一过性升高、白细胞减少、血小板减少、神经毒性和肾毒性等。

【用法与用量】口服：(1) 成人：链球菌感染，一次 125～250 mg（20 万～40 万 U），每 6～8 小时 1 次，疗程 10 日。肺炎球菌感染，一次 250～500 mg（40 万～80 万 U），每 6 小时 1 次，疗程至退热后至少 2 日。葡萄球菌感染、螺旋体感染（樊尚咽峡炎），一次 250～500 mg，每 6～8 小时 1 次。预防风湿热复发，一次 250 mg（40 万 U），一日 2 次。预防心内膜炎，在拔牙或上呼吸道手术前 1 小时口服本品 2 g（320 万 U），6 小时后再加服 1 g（27 kg 以下小儿剂量减半）。(2) 小儿：按体重，一次 2.5～9.3 mg（4 000～15 000 U）/kg，每 4 小时 1 次；或一次 3.75～14 mg（4 000～22 000 U）/kg，每 6 小时 1 次；或一次 5～18.7 mg（8 000～30 000 U）/kg，每 8 小时 1 次。

【制剂与规格】青霉素 V 钾片：① 100 万 U；② 60 万 U；③ 250 mg（40 万 U）；④ 125 mg（20 万 U）。

苯唑西林 [基(基)，保(乙)]

Oxacillin

【适应证】(1) 用于治疗产青霉素酶葡萄球菌感染，包括败血症、心内膜炎、肺炎和皮肤、软组织感染等。(2) 化脓性链球菌或肺炎球菌与耐青霉素葡萄球菌所致的混合感染。

【注意事项】儿童用药：新生儿尤其早产儿应慎用。其他见青霉素。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史者或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应：见青霉素。(2) 静脉使用偶可产生恶心、呕吐和 ALT 及 AST 升高。(3) 大剂量静脉滴注本品可引起抽搐等中枢神经系统毒性反应。(4) 有报道婴儿使用大剂量后出现血尿、蛋白尿和尿毒症。

【用法与用量】(1) 肌内注射，成人每 0.5 g 加灭菌注射用水 2.8 ml。一日 4～6 g，分 4 次给药；静脉滴注一日 4～8 g，分 2～4 次给药，严重感染一日剂量可增加至 12 g。(2) 小儿肌内或静脉注射时，体重 40 kg 以下者，每 6 小时按体重给予 12.5～25 mg/kg，体重超过 40 kg 者予以成人剂量。新生儿体重低于 2 kg 者，日龄 1～14 日者每 12 小时按体重 25 mg/kg，日龄 15～30 日者每 8 小时按体重 25 mg/kg；体重超过 2 kg 者，日龄 1～14 日者每 8 小时按体重 25 mg/kg，日龄 15～30 日者每 6 小时按体重 25 mg/kg。(3) 轻、中度肾功能减退患者不需调整剂量，严重肾功能减退患者应避免应用大剂量，以防中枢神经系统毒性

反应发生。

【制剂与规格】注射用苯唑西林钠（按苯唑西林计算）：① 0.5 g；② 1.0 g。

氯唑西林[保（甲）]

Cloxacillin

【适应证】(1) 用于治疗产青霉素酶葡萄球菌感染，包括败血症、心内膜炎、肺炎和皮肤、软组织感染等。(2) 也可用于化脓性链球菌或肺炎球菌与耐青霉素葡萄球菌所致的混合感染。

【注意事项】(1) 见青霉素注意事项前两条。(2) 本品降低患者胆红素与血清蛋白结合能力，新生儿尤其是有黄疸者慎用。(3) 对孕妇和哺乳期妇女用药：见青霉素。(4) 儿童用药：新生儿尤其早产儿应慎用。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史者或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应：见青霉素。(2) 静脉注射偶可产生恶心、呕吐和 ALT 及 AST 升高。(3) 大剂量注射可引起抽搐等中枢神经系统毒性反应。(4) 有报道婴儿使用大剂量后出现血尿、蛋白尿和尿毒症。(5) 个别病例发生粒细胞缺乏症或淤胆型黄疸。

【用法与用量】(1) 肌内注射：注射时可加 0.5% 利多卡因减少局部疼痛。①成人，一日 2 g，分 4 次；②小儿，一日按体重 25 ~ 50 mg/kg，分 4 次。(2) 静脉滴注：①成人，一日 4 ~ 6 g，分 2 ~ 4 次；②小儿，一日按体重 50 ~ 10 mg/kg，分 2 ~ 4 次。③体重低于 2 kg 的新生儿：日龄 1 ~ 14 日者每 12 小时按体重给予 25 mg/kg；日龄 15 ~ 30 日者每 8 小时按体重给予 25 mg/kg；体重超过 2 kg 的新生儿，日龄 1 ~ 14 日者，每 8 小时按体重给予 25 mg/kg。日龄 15 ~ 30 日者，每 6 小时按体重给予 25 mg/kg。④轻、中度肾功能减退患者不需调整剂量，严重肾功能减退患者应避免应用大剂量，以防中枢神经系统毒性反应发生。

【制剂与规格】注射用氯唑西林钠（按氯唑西林计算，下同）：① 0.5 g；② 1.0 g。

氯唑西林钠胶囊：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5 g。

氯唑西林钠颗粒：① 0.125 g；② 50 mg。

氟氯西林

Flucloxacillin

【适应证】(1) 葡萄球菌所致的各种周围感染，但对耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌（MRSA）感染无效。(2) 产青霉素酶葡萄球菌所致的各种感染，包括软组织感染，如脓肿、疖、痈、蜂窝织炎、创口感染、烧伤、中 / 外耳炎、皮肤移植保护、皮肤溃疡、湿疹、痤疮、手术预防用药。(3) 呼吸道感染，如肺炎、脓胸、肺脓肿、鼻窦炎、咽炎及扁桃腺炎。(4) 其他感染，如心内膜炎、脑膜炎、败血症、奈瑟菌感染、败血症性流产、产褥期感染、骨髓炎。

【注意事项】(1) 与青霉素有交叉过敏反应，应用前须做本品或青霉素过敏试验，方法同青霉素。过敏者禁用。(2) 可加入到常用的静脉注射液体中，如氯化钠注射液、5% 葡萄糖或 1/6 mol/L 乳酸钠。但勿与血液、血浆、水解蛋白、氨基酸以及脂肪乳配伍注射。(3) 本品可使氨基糖苷类抗生素降低疗效，不可配伍。(4) 慢性、复发和严重感染或吸收不良时，宜选用非胃肠道给药。非胃肠道给药溶液最好在药液配制后数小时内使用，使用前充分振摇，缓慢注射。(5) 传染性单核细胞增多症和淋巴细胞性白血病患者常出现药疹。(6) 青霉素类与头孢菌素类合用可以出现交叉过敏或交叉耐药性。(7) 本品不宜结膜下和鞘膜内注射。(8) 长期用药偶见导致非敏感细菌过度生长。(9) 由于本品可少量分泌入乳汁，因此有引起婴儿致敏的危险，但这种危险很小。

【禁忌证】对青霉素或本品其他成分过敏者。

【不良反应】(1) 与青霉素相似，可发生各种过敏反应，但较少。(2) 偶见胃肠道不良反应如轻度而短暂的恶心、呕吐、腹泻、肝炎和胆汁淤积性黄疸。(3) 可见典型的过敏反应，如荨麻疹、紫癜、斑疹和斑丘疹。(4) 大剂量非肠道给药可出现神经毒性、中性粒细胞减少症和白细胞减少症。(5) 静脉给药曾观察到血栓性静脉炎。(6) 食物会干扰本品在胃肠吸收，宜空腹口服给药，饭前 1 小时为宜。

【用法与用量】(1) 肌内注射或静脉注射：①成人：肌内注射常用量一次 250 mg，一日 3 次；重症一次 500 mg，一日 4 次；静脉注射：一次 500 mg，一日 4 次，将药物溶于 10 ~ 20 ml 注射用水或葡萄糖输液中静脉注射，每 4 ~ 6 小时 1 次。1 日量不超过 8 g。②儿童：2 岁以下按成人量的 1/4；2 ~ 10 岁按成人量的 1/2，根据体重适当调整。也可按照一日 25 ~ 50 mg/kg，分次给予。(2) 口服：①成人一次 0.25 g，一日 4 次，应于饭前至少半小时服用，重症感染，剂量加倍。②儿童参考用量：据文献资料记载，2 岁以下按成人口服剂量的 1/4 给药；2 ~ 10 岁按成人剂量的 1/3 给药。

【制剂与规格】氟氯西林片：0.125 g。
氟氯西林胶囊：① 0.25 g；② 0.5 g。
注射用氟氯西林钠：① 0.5 g；② 1 g。

氨苄西林 [基(基)，保(甲)]

Ampicillin

【适应证】用于敏感菌所致的呼吸道感染、胃肠道感染、尿路感染、软组织感染、心内膜炎、脑膜炎、败血症等。

【注意事项】(1) 应用本品前需详细询问药物过敏史并进行青霉素皮肤试验。(2) 传染性单核细胞增多症、巨细胞病毒感染、淋巴细胞白血病、淋巴瘤患者应用本品时易发生皮疹，宜避免使用。(3) 本品须新鲜配制。氨苄西林钠溶液浓度愈高，稳定性愈差。在 5℃时 1% 氨苄西林钠溶液能保持其生物效价 7 日，但 5% 的溶液则为 24 小时。浓度为 30 mg/ml 的氨苄西林钠静脉滴注液在室温放置 2 ~ 8 小时仍能至少保持其 90% 的效价，放置冰箱内则可保持其 90% 的效价至 72 小时。稳定性可因葡萄糖、果糖和乳酸的存在而降低，亦随温度升高而降低。(4) 孕妇及哺乳期妇女用药：尚无本品在孕妇应用的严格对照试验，所以孕妇应仅在确有必要时使用本品。少量本品从乳汁中分泌，哺乳期妇女用药时宜暂停哺乳。

【不良反应】不良反应与青霉素相仿，以过敏反应较为常见。(1) 皮疹是最常见的反应，多发生于用药后 5 日，呈荨麻疹或斑丘疹。(2) 亦可发生间质性肾炎。(3) 过敏性休克偶见，一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及给用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。(4) 偶见粒细胞和血小板减少。(5) 少见抗生素相关性肠炎。(6) 少数患者出现 ALT 及 AST 升高。(7) 大剂量氨苄西林静脉给药可发生抽搐等神经系统毒性症状。(8) 婴儿应用氨苄西林后可出现颅内压增高，表现为前囟隆起。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【用法与用量】(1) 口服：宜空腹口服。①成人一次 0.5 g，一日 3 次；②儿童 6 ~ 12 岁 0.25 g，2 ~ 6 岁 0.17 g，一日 3 次。1 岁以下儿童一日按体重 0.05 ~ 0.15 g/kg，分 3 ~ 4 次服用。或遵医嘱。(2) 肌内注射：注射时将氨苄西林钠 125 mg、500 mg 和 1 g 分别溶解于 0.9 ~ 1.2 ml、1.2 ~ 1.8 ml 和 2.4 ~ 7.4 ml 灭菌注射用水。①成人：一日 2 ~ 4 g，分 4 次给药。②儿童：一日按体重 50 ~ 100 mg/kg，分 4 次给药。(3) 静脉滴注或注射：氨苄西林钠静脉滴注液的浓度不宜超过 30 mg/ml。①成人：一日 4 ~ 8 g，分 2 ~ 4 次给药。重症感染患者一日剂量可以增加至 12 g，一日最高剂量为 14 g。②儿童：一日按体重 100 ~ 200 mg/kg，分 2 ~ 4 次给药。一日最高剂量为按体重 300 mg/kg。③足月新生儿：按体重一次 12.5 ~ 25 mg/kg，出生第 1、2 日每 12 小时 1 次，第 3 日 ~ 2 周每 8 小时 1 次，以后每 6 小时 1 次。④早产儿：出生第 1 周、1 ~ 4 周和 4 周以上一次 12.5 ~ 50 mg/kg，分别为每 12 小时、8 小时和 6 小时 1 次，静脉滴注给药。⑤肾功能不全者：内生肌酐清除率为每分钟 10 ~ 50 ml 或小于每分钟 10 ml 者，给药间期应分别延长至 6 ~ 12 小时和 12 ~ 24 小时。

【制剂与规格】氨苄西林钠胶囊：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5 g。

注射用氨苄西林钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

磺苄西林 [保(乙)]

Sulbenicillin

【适应证】用于对本品敏感的铜绿假单胞菌、某些变形杆菌属及其他敏感革兰

阴性菌所致肺炎、尿路感染、复杂性皮肤软组织感染和败血症等。对本品敏感菌所致腹腔感染、盆腔感染宜与抗厌氧菌药联合应用。

【注意事项】(1) 使用本品前需详细询问药物过敏史并进行青霉素皮肤试验，呈阳性反应者禁用。(2) 对一种青霉素过敏者可能对其他青霉素类药物、青霉胺过敏。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应较常见，包括皮疹、发热等；偶见过敏性休克，一旦发生须就地抢救，保持气道畅通、吸氧及给予用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。(2) 恶心、呕吐等胃肠道反应。(3) 实验室检查异常包括白细胞或中性粒细胞减少，ALT 及 AST 一过性增高等。

【用法与用量】静脉滴注或静脉注射：中度感染，成人一日 8 g，分 4 次给药；重症感染或铜绿假单胞菌感染，剂量增至一日 20 g，分 4 次给药；儿童，根据病情每日剂量按体重 80 ~ 300 mg/kg，分 4 次给药。

【制剂与规格】注射用磺苄西林钠：1 g : 100 万 U。

阿莫西林 [基(基)，保(甲)]

Amoxicillin

【适应证】用于敏感菌（不产 β－内酰胺酶菌株）所致的下列感染：(1) 溶血链球菌、肺炎链球菌、葡萄球菌或流感嗜血杆菌所致中耳炎、鼻窦炎、咽炎、扁桃体炎等上呼吸道感染。(2) 大肠埃希菌、奇异变形杆菌或粪肠球菌所致的泌尿生殖道感染。(3) 溶血链球菌、葡萄球菌或大肠埃希菌所致的皮肤软组织感染。(4) 溶血链球菌、肺炎链球菌、葡萄球菌或流感嗜血杆菌所致急性支气管炎、肺炎等下呼吸道感染。(5) 急性单纯性淋病。(6) 伤寒、伤寒带菌者及钩端螺旋体病；亦可与克拉霉素、兰索拉唑三联口服用药根除胃、十二指肠幽门螺杆菌，降低消化道溃疡复发率。

【注意事项】(1) 青霉素类药物偶可致过敏性休克，尤多见于有青霉素或头孢菌素过敏史的患者。用药前必须详细询问药物过敏史并做青霉素皮肤试验。如发生过敏性休克，应就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及应用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。(2) 传染性单核细胞增多症患者应用本品易发生皮疹，应避免使用。(3) 疗程较长患者应检查肝、肾功能和血常规。(4) 对诊断的干扰：导致采用 Benedit 或 Fehling 试剂的尿糖试验出现假阳性。(5) 下列情况应慎用：①有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病史者。②老年人和肾功能严重损害时可能须调整剂量。(6) 孕妇及哺乳期妇女用药：①动物生殖实验显示，10 倍于人类剂量的阿莫西林未损害大鼠和小鼠的生育力和胎仔。但在人类尚缺乏足够的对照研究，鉴于动物生殖实验不能完全预测人体反应，孕妇应仅在确有必要时应用本品。②由于乳汁中可分泌少量阿莫西林，乳母服用后可能导致婴儿过敏。(7) 类似其他广谱抗生素，有可能发生由白色念珠菌等非敏感微生物引起的二重感染，尤其是慢性病患者和自身免疫功能失调者。

【禁忌证】青霉素过敏及青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【不良反应】(1) 恶心、呕吐、腹泻及抗生素相关性肠炎等胃肠道反应。(2) 皮疹、药物热和哮喘等过敏反应。(3) 贫血、血小板减少、嗜酸性粒细胞增多等。(4) ALT 及 AST 可轻度增高。(5) 由念珠菌或耐药菌引起的二重感染。(6) 偶见兴奋、焦虑、失眠、头晕以及行为异常等中枢神经系统症状。

【用法与用量】(1) 口服：①成人一次 0.5 g，每 6 ~ 8 小时 1 次，一日剂量不超过 4 g。②小儿一日 20 ~ 40 mg/kg，每 8 小时一次服用。③ 3 个月以下婴儿一日剂量按体重 30 mg/kg，每 12 小时 1 次。(2)肌内注射或稀释后静脉滴注给药：①成人一次 0.5 ~ 1 g，每 6 ~ 8 小时 1 次。②小儿一日剂量按体重 50 ~ 100 mg/kg，分 3 ~ 4 次给药。(3) 肾功能严重损害患者需调整给药剂量：①内生肌酐清除率为每分钟 10 ~ 30 ml 者每 12 小时 0.25 ~ 0.5 g。②内生肌酐清除率小于每分钟 10 ml 者每 24 小时 0.25 ~ 0.5 g。③血液

透析可清除本品，一次血液透析后应给予1 g。

【制剂与规格】阿莫西林片：① 0.125 g；② 0.25 g。

阿莫西林胶囊：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5g。

阿莫西林干混悬剂：①袋装 0.125 g；②袋装 0.25 g；③瓶装 1.25 g；④瓶装 2.5 g。

阿莫西林颗粒剂：0.125 g。

注射用阿莫西林钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

注射用阿莫西林舒巴坦钠：① 0.75 g（阿莫西林 0.5 g，舒巴坦 0.25 g）；② 1.5 g（阿莫西林 1 g，舒巴坦 0.5 g）。用于敏感菌所致的下呼吸道、中耳、鼻窦、皮肤组织、尿路等部位感染，对肠杆菌属尿路感染也可有效。静脉滴注：一日 4.5 ~ 6 g，分 2 ~ 3 次给药，严重感染时可增至 9 g，7 ~ 14 日为 1 个疗程。肌内注射的用法与用量参见静脉滴注。阿莫西林舒巴坦匹酯片：0.5 g（阿莫西林 0.25 g，舒巴坦 0.25 g）。口服：一次 0.5 ~ 1 g，一日 3 次。儿童：9 个月 ~ 2 岁，一次 0.125 g，一日 3 次；2 ~ 6 岁，一次 0.25 g，一日 3 次；6 ~ 12 岁，一次 0.5 g，一日 3 次；12 岁以上，一次 0.5 ~ 1 g，一日 3 次。

阿莫西林克拉维酸钾 [基(基)，保(甲)]

Amoxicillin and Clavulanate Potassium

【适应证】(1) 上呼吸道感染：鼻窦炎、扁桃体炎、咽炎。(2) 下呼吸道感染：急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、肺炎、肺脓肿和支气管扩张合并感染。(3) 泌尿系统感染：膀胱炎、尿道炎、肾盂肾炎、前列腺炎、盆腔炎、淋病奈瑟菌尿路感染。(4) 皮肤和软组织感染：疖、脓肿、蜂窝织炎、伤口感染、腹内脓毒病等。(5) 其他感染：中耳炎、骨髓炎、败血症、腹膜炎和手术后感染。(6) 还可用于预防大手术感染，如胃肠、盆腔、头、颈、心脏、肾、关节移植和胆道手术。

【注意事项】(1) 一次开始使用前，必须先进行青霉素皮试。(2) 对头孢菌素类药物过敏者、严重肝功能障碍者、中度或严重肾功能障碍者及有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病史者慎用。(3) 与其他青霉素类和头孢菌素类药物之间有交叉过敏性。若有过敏反应产生，则应立即停用本品，并采取相应措施。(4) 和氨苄西林有完全交叉耐药性，与其他青霉素类和头孢菌素类有交叉耐药性。(5) 肾功能减退者应根据血浆肌酐清除率调整剂量或给药间期；血液透析可影响阿莫西林克拉维酸钾中阿莫西林的血药浓度，因此在血液透析过程中及结束时应加用本品 1 次。(6) 对怀疑为伴梅毒损害之淋病患者，在使用本品前应进行暗视野检查，并至少在 4 个月内，每月接受血清试验 1 次。(7) 长期或大剂量使用阿莫西林克拉维酸钾者，应定期检查肝、肾、造血系统功能和检测血清钾或钠。(8) 对诊断的干扰：①见阿莫西林，糖酶试验法不受影响；②可使血清 ALT 及 AST 升高。(9) 溶解后应立即给药，剩余药液应废弃，不可再用。制备好的本品溶液不能冷冻保存。(10) 不能与含有葡萄糖、葡聚糖或酸性碳酸盐的溶液混合。也不可与血制品、含蛋白质的液体（如水解蛋白等）、静脉脂质乳化液混合。也不能与氨基糖苷类抗生素混合。(11) 哺乳期妇女用药：哺乳期妇女慎用或用药期间暂停哺乳。(12) 老年患者用药：老年患者应根据肾功能情况调整用药剂量或用药间期。

【禁忌证】青霉素皮试阳性反应者、对本品及其他青霉素类药物过敏者及传染性单核细胞增多症患者禁用。孕妇禁用。

【不良反应】(1) 少数患者可见恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应，对症治疗后可继续给药。(2) 偶见荨麻疹和皮疹（尤易发生于传染性单核细胞增多症者），若发生，应停药，并对症治疗。(3) 可见过敏性休克、药物热和哮喘等。(4) 偶见 ALT 及 AST 升高、嗜酸性粒细胞增多、白细胞减少及念珠菌或耐药菌引起的二重感染。(5) 个别患者注射部位出现静脉炎。

【用法与用量】(1) 口服：①片剂。成人和 12 岁以上小儿，一次 1.0 g，一日 3 次。严重感染时剂量可加倍。未经重新检查，连续治疗期不超过 14 日。②干混悬剂、颗粒剂、咀嚼片、分散片。成人，

肺炎及其他中、重度感染，一次 625 mg，每 8 小时 1 次，疗程 7 ~ 10 日；其他感染，一次 375 mg，每 8 小时 1 次，疗程 7 ~ 10 日。新生儿及 3 个月以内婴儿，按阿莫西林计算（下同），按体重一次 15 mg/kg，每 12 小时 1 次。体重 ≤ 40 kg 的小儿，一般感染，按体重一次 25 mg/kg，每 12 小时 1 次或按体重一次 20 mg/kg，每 8 小时 1 次；较重感染，按体重一次 45 mg/kg，每 12 小时 1 次，或按体重一次 40 mg/kg，每 8 小时 1 次。疗程 7 ~ 10 日。其他感染剂量减半。40 kg 以上的儿童可按成人剂量给药。③肾功能减退者：肌酐清除率每分钟 > 30 ml 者不需减量；肌酐清除率每分钟 10 ~ 30 ml 者每 12 小时口服本品 250 ~ 500 mg(以阿莫西林计，下同)；肌酐清除率每分钟 < 10 ml 者每 24 小时口服本品 250 ~ 500 mg。血液透析患者，根据病情轻重，每 24 小时口服本品 250 ~ 500 mg；在血液透析过程中及结束时各加服 1 次。(2) 静脉注射或静脉滴注：①成人或 12 岁以上儿童，一次 1.2 g，每 8 小时 1 次，严重感染可每 6 小时 1 次。②小儿，3 个月至 12 岁，一次 30 mg/kg，每 8 小时 1 次；严重感染可每 6 小时 1 次。③新生儿与 3 个月以内婴儿，一次 30 mg/kg，每 12 小时 1 次；随后每 8 小时 1 次。④肾功能不全患者：肌酐清除率大于每分钟 30 ml 时不需减量；肌酐清除率每分钟 10 ~ 30 ml 者，静脉滴注首剂 1.2 g，随后每 12 小时 0.6 g；肌酐清除率小于每分钟 10 ml 者，静脉滴注首剂 1.2 g，继以每 24 小时 0.6 g；血液透析患者在血液透析结束后补充 0.6 g。(3) 成人预防手术感染用量：于诱导麻醉时静脉给予本品 1.2 g。对于有高感染危险性的手术，如结肠手术患者，可在 24 小时内给予 3 ~ 4 次本品，一次 1.2 g，可于 0、8、16、24 小时给药。如果手术中感染的危险性增加，可继续按此方案给药数日。如果术中有明显的感染迹象，术后需继续静脉注射本品或口服给予阿莫西林克拉维酸钾片 1 个疗程。

【制剂与规格】阿莫西林克拉维酸钾片：① 1.0 g [阿莫西林 0.875 g，克拉维酸钾（以克拉维酸计，下同）0.125 g]；② 0.375 g（阿莫西林 0.25 g，克拉维酸钾 0.125 g)；③ 0.643 g（阿莫西林 0.6 g，与克拉维酸钾 0.043 g)。

阿莫西林克拉维酸钾分散片：① 156.25 mg（阿莫西林 125 mg，克拉维酸钾 31.25 mg)；② 0.5 g(阿莫西林 0.4375 g，克拉维酸钾 0.0625 g)；③ 643 mg（阿莫西林 0.6 g，克拉维酸钾 43 mg)；④ 187.5 mg（阿莫西林 125 mg，克拉维酸钾 62.5 mg)。

阿莫西林克拉维酸钾咀嚼片：① 156.25 mg（阿莫西林 0.125 g，克拉维酸钾 31.25 mg)；② 281.25 mg（阿莫西林 250 mg，克拉维酸钾 31.25 mg)；③ 187.5 mg（阿莫西林 0.125 g，克拉维酸钾 62.5 mg)。

阿莫西林克拉维酸钾混悬液：5 ml ∶ 0.228 g（阿莫西林 0.20 g，克拉维酸钾 0.028 g)。

阿莫西林克拉维酸钾干混悬剂：① 0.6429 g（阿莫西林 600 mg，克拉维酸钾 42.9 mg)；② 1 g ∶ 156.25 mg（阿莫西林 125 mg，克拉维酸钾 31.25 mg)；③ 228.5 mg（阿莫西林 0.2 g，克拉维酸钾 28.5 mg)。

阿莫西林克拉维酸钾颗粒剂：156.25 mg（阿莫西林 125 mg，克拉维酸 31.25 mg)。

注射用阿莫西林钠克拉维酸钾：① 0.6 g（阿莫西林钠 0.5 g，克拉维酸钾 0.1 g)；② 1.2 g（阿莫西林钠 1.0 g，克拉维酸钾 0.2 g)。

氨苄西林舒巴坦钠[保(乙)]

Ampicillin and Sulbactam Sodium

【适应证】(1) 敏感细菌所引起的感染：鼻窦炎、中耳炎、会厌炎、细菌性肺炎等上、下呼吸道感染；肾盂肾炎；腹膜炎、胆囊炎、子宫内膜炎；细菌性菌血症；皮肤、软组织、骨关节感染；淋球菌感染。(2) 围手术期注射本品以降低腹部和盆腔手术后患者伤口感染的发生率。在终止妊娠或行剖宫产手术时，作为预防用药以减少手术后发生脓毒血症的危险。

【注意事项】(1) 有发生严重的或偶发致死过敏反应的报道。在应用前，应仔细询问患者对青霉素类、头孢菌素类抗生

素，以及其他过敏原的既往过敏反应史。一旦发生过敏反应，应停药并给予妥善处理。严重过敏反应时，须立即给予肾上腺素紧急治疗，根据病情采取吸氧、静脉注射激素，及包括气管插管在内的通气治疗措施。(2) 用药时应持续观察患者是否存在不敏感微生物，包括真菌过度生长的征象。一旦发生二重感染，应停药并给予妥善处理。(3) 建议在延长治疗期间，应定期检查患者是否存在器官、系统的功能障碍，包括肾脏、肝脏和造血系统。这点对于新生儿，特别是早产儿和其他婴儿尤其重要。(4) 传染性单核细胞增多症患者接受氨苄西林治疗后可使皮疹的发生率升高。(5) 用前需做青霉素钠皮内敏感试验，阳性反应者禁用。(6) 由于在体外任何氨基青霉素均可使氨基糖苷类抗生素灭活，因此注射用氨苄西林钠舒巴坦钠不应与氨基糖苷类抗生素在同一容器中混合。(7) 注射用氨苄西林钠舒巴坦钠在葡萄糖或其他含糖溶液中的稳定性较差。(8) 不应与血液制品或蛋白质的水解产物混合。(9) 肌内注射液应在配制后1小时内使用。各种稀释后静脉注射液的使用期限见表9-3。(10) 孕妇及哺乳期妇女用药：动物生殖研究结果表明，氨苄西林舒巴坦钠不会对生育能力和胎仔造成损害，舒巴坦钠可通过胎盘屏障。尚无本品用于孕妇和哺乳妇女方面的资料。

【禁忌证】禁用于对任何青霉素类抗生素有过敏反应史的患者。

【不良反应】(1) 注射部位疼痛，尤其是肌内注射部位的疼痛。少数患者静脉注射后可发生静脉炎或注射部位反应。(2) 免疫系统：过敏反应和过敏性休克。(3) 神经系统：罕有报道发生惊厥。(4) 胃肠道：恶心、呕吐、腹泻、小肠结肠炎和抗生素相关性肠炎。(5) 血液和淋巴系统：有报道，应用氨苄西林钠舒巴坦钠治疗期间，可出现贫血、溶血性贫血、血小板减少、嗜酸性粒细胞增多和白细胞减少。停药后可恢复正常，已证实上述情况为过敏反应所致。(6) 实验室检查：一过性 ALT 及 AST 升高。(7) 肝胆系统：胆红素血症，肝功能异常和黄疸。(8) 皮肤和皮下组织：皮疹、瘙痒和其他皮肤反应，罕有报道发生 Stevens-Johnson 综合征，表皮坏死和多形性红斑。(9) 肾脏和泌尿道：罕有报道发生间质性肾炎。

【用法与用量】深部肌内注射、静脉注射或静脉滴注。将一次药量溶于 50 ~ 100 ml 稀释液中，于 10 ~ 15 分钟静脉滴注。成人一次 1.5 ~ 3 g（氨苄西林钠舒巴坦钠，下同），每 6 小时 1 次。肌内注射一日剂量不超过 6 g；静脉用药一日剂量不超过 12 g（舒巴坦钠一日剂量最

表 9-3　各种静脉注射液的使用期限

稀释用溶液	稀释后药物浓度 (mg/ml)	存放温度 (℃)	使用期限 (小时)
灭菌注射用水或等渗氯化钠溶液	45	25	8
	45	4	8
	30	4	72
1/6 mol/L 乳酸钠溶液	45	25	8
	45	4	8
5% 葡萄糖溶液	15 ~ 30	25	2
	15 ~ 30	4	4
	3	25	4
5% 葡萄糖 + 0.45% 氯化钠溶液	3	25	4
	15	4	4
10% 转化糖溶液	3	25	4
	30	4	3
乳酸钠林格溶液	45	25	8
	45	4	24

高不超过4g)。儿童按体重一日100～200mg/kg，分次给药。肾功能受损患者的患者（肌酐清除率每分钟≤30ml)，应减少给药次数。

【制剂与规格】注射用氨苄西林舒巴坦钠：①0.75g（氨苄西林钠0.5g，舒巴坦钠0.25g)；②1.5g（氨苄西林钠1.0g，舒巴坦钠0.5g)；③1g（舒巴坦钠0.5g，氨苄西林钠0.5g)；④3g（氨苄西林钠2g，舒巴坦钠1g)。

氨苄西林钠舒巴坦钠片：375mg（氨苄西林钠250mg，舒巴坦钠125mg)。

替卡西林

Ticarcillin

【适应证】革兰阴性菌感染，包括变形杆菌、大肠埃希菌、肠杆菌属、淋球菌、流感杆菌等所致全身感染。铜绿假单胞菌感染，对于铜绿假单胞菌所致的下呼吸道感染、骨关节感染、腹腔感染、盆腔感染、尿路感染、败血症和皮肤、软组织感染等，常需与氨基糖苷类或氟喹诺酮类药物联合应用。

【注意事项】与青霉素有交叉过敏反应，应用前应须做青霉素过敏试验，方法同青霉素，过敏者禁用。对头孢菌素过敏者，严重肝、肾功能损害患者及凝血功能异常者慎用本品。肾功能减退者需根据内生肌酐清除率调整给药剂量。肾功能不全的患者，使用本品的双钠盐，可使钠负荷增加。肌内注射后偶有局部疼痛和静脉滴注后发生静脉炎等。亦有ALT及AST增高，但停药后会恢复。本品与庆大霉素合用时，不宜放于同一滴注瓶内应用。其他见青霉素的注意事项。

【禁忌证】对本品或其他青霉素类过敏者禁用。

【不良反应】(1) 低钾血症及出血时间延长。应用丙磺舒可减少钾从尿中排出。(2) 皮疹、瘙痒、药物热等过敏反应较多见。大剂量用于肾功能减退者可出现凝血功能异常而发生紫癜、黏膜和注射部位出血，一旦出血发生，立即停药。

【用法与用量】成人，一日量200～300mg/kg，分次给予，或1次3g，根据病情每3、4或6小时1次。按每克药物用4ml溶剂溶解后缓缓静脉注射或加入适量溶剂中静脉滴注0.5～1小时。泌尿系感染可肌内注射给药，一次1g，一日4次，用0.25%～0.5%利多卡因注射液2～3ml溶解后深部肌内注射。肾功能减退者首剂3g，维持剂量，肌酐清除率为每分钟30～60ml者，每4小时2g；为每分钟10～30ml者，每8小时2g；小于每分钟10ml者，每12小时2g。儿童1日用量为200～300mg/kg。婴儿一日量为225mg/kg，7日龄以下婴儿则为一日150mg/kg，均分次给予。儿童一日200～300mg/kg，每3～6小时静脉滴注1次。

【制剂与规格】注射用替卡西林钠：①0.5g；②1g；③3g；④6g。

替卡西林克拉维酸钾[保(乙)]

Ticarcillin and Clavulanate Potassium

【适应证】用于各种敏感菌感染。①严重感染，如败血症、菌血症、腹膜炎、腹腔内脓肿、特殊人群（继发于免疫系统抑制或受损）的感染、术后感染、骨及关节感染、皮肤及软组织感染、呼吸道感染、严重的或复杂的泌尿道感染（如肾盂肾炎)。②耳、鼻、喉感染。

【注意事项】(1) 见替卡西林的注意事项。(2) 注射用溶液应随用随配，配制好的注射液应立即使用。替卡西林克拉维酸钾在碳酸氢钠溶液中不稳定。替卡西林克拉维酸钾不可与血制品或蛋白质水溶液（如水解蛋白或静注脂质乳剂）混合使用。(3) 与氨基糖苷类抗生素合用治疗（包括铜绿假单胞菌感染)，两种药物应分别给药。

【不良反应】见替卡西林的不良反应。可发生胃肠道反应，如恶心、呕吐和腹泻并罕见低钾血症。

【禁忌证】对β-内酰胺类抗生素过敏者禁用。

【用法与用量】(1) 用法：①静脉滴注，不用于肌内注射。②使用时，将1.6g或3.2g用10ml无菌注射用水相应的50ml或100ml，或5%葡萄糖注射液相应的100ml或100～150ml溶解，然后

再移至输液容器中，稀释成相应容积溶液后于30～40分钟静脉滴注。(2) 用量：①成人（包括老年人）常用剂量：一次1.6～3.2g，每6～8小时给药1次，最大剂量：一次3.2g，每4小时给药1次。②肾功能不全患者的推荐剂量：轻度受损（肌酐清除率每分钟＞30ml）每8小时3.2g；中度受损（肌酐清除率每分钟10～30ml）每8小时1.6g；严重受损（肌酐清除率每分钟<10ml）每12小时1.6g。③儿童：常用剂量：按体重，一次80mg/kg，每6～8小时给药1次；新生儿期的用量，一次80mg/kg，每12小时给药1次，继而可增至每8小时给药1次。肾功能不全患儿的用量，须参照成人肾功能不全患者的推荐剂量进行调整。

【制剂与规格】注射用替卡西林克拉维酸钾：①1.6g（替卡西林1.5g与克拉维酸0.1g)；②3.2g（替卡西林3.0g与克拉维酸0.2g)。

哌拉西林[基（基）、保（甲）]

Piperacillin

【适应证】(1) 敏感肠杆菌科细菌、铜绿假单胞菌、不动杆菌属所致的败血症、上尿路及复杂性尿路感染、呼吸道感染、胆道感染、腹腔感染、盆腔感染以及皮肤、软组织感染等。(2) 与氨基糖苷类抗生素联合可用于有粒细胞减少症免疫缺陷患者的感染。

【注意事项】(1) 使用前需详细询问药物过敏史并进行青霉素皮肤试验，呈阳性反应者禁用。(2) 对一种青霉素过敏者可能对其他青霉素类药物过敏；对头孢菌素类、头霉素类、灰黄霉素或青霉胺过敏者，对本品也可能过敏。(3) 哌拉西林在少数患者尤其是肾功能不全患者可导致出血，发生后应及时停药并予适当治疗；肾功能减退者应适当减量。(4) 有过敏史、出血史、溃疡性结肠炎、克罗恩病或抗生素相关肠炎者皆应慎用。(5) 哌拉西林不可加入碳酸氢钠溶液中静脉滴注。(6) 孕妇及哺乳期妇女用药：①动物生殖实验未发现本品有损害，但尚未在孕妇中进行严格对照试验以排除这类药物对胎儿的不良影响，所以孕妇应仅在确有必要时使用本品。②少量本品从乳汁中分泌，哺乳期妇女用药时宜暂停哺乳。

【不良反应】(1) 过敏反应：青霉素类药物过敏反应较常见，包括荨麻疹等各类皮疹、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作和血清病型反应，严重者如过敏性休克偶见；过敏性休克一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及给用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。(2) 局部症状：局部注射部位疼痛、血栓性静脉炎等。(3) 消化道症状：腹泻、稀便、恶心、呕吐等；抗生素相关性肠炎罕见。(4) 个别患者可出现胆汁淤积性黄疸。(5) 中枢神经系统症状：头痛、头晕和疲倦等。(6) 肾功能减退者应用大剂量时，因脑脊液浓度增高，出现青霉素脑病，故此时应按肾功能进行剂量调整。(7) 其他：念珠菌二重感染、出血等。

【禁忌证】有青霉素类药物过敏史或青霉素皮肤试验阳性患者禁用。

【用法与用量】本品可供静脉滴注和静脉注射。(1) 成人：中度感染一日8g，分2次静脉滴注；严重感染一次3～4g，每4～6小时静脉滴注或注射。一日总剂量不超过24g。(2) 儿童：婴幼儿和12岁以下儿童的剂量为一日按体重100～200mg/kg。新生儿体重低于2kg者，出生后第1周每12小时50mg/kg，静脉滴注；第2周起50mg/kg，每8小时1次。新生儿体重2kg以上者出生后第1周每8小时50mg/kg，静脉滴注；1周以上者每6小时50mg/kg。

【制剂与规格】注射用哌拉西林钠（按哌拉西林计)：①0.5g；②1.0g；③2.0g。

哌拉西林舒巴坦[保（乙）]

Piperacillin and Sulbactam

【适应证】用于由对哌拉西林耐药对本品敏感的产β-内酰胺酶致病菌引起的下列感染：在用于治疗对哌拉西林单药敏感菌与对哌拉西林单药耐药、对本品敏感的产β-内酰胺酶菌引起的混合感染时，不需要加用其他抗生素。(1) 呼吸系统感染：包括急性支气管炎、肺炎、慢性支气管炎急性发作、支气管扩张合并感染等。(2) 泌尿系统感染：包括单纯型泌尿系统

感染和复杂型泌尿系统感染。

【注意事项】(1) 用前需做青霉素皮肤试验。(2) 肾功能不全者慎用，用药期间应检测肾功能，如发现肾功能异常应及时调整治疗方案。(3) 哌拉西林可能引起出血，有出血倾向的患者应检查凝血时间、血小板聚集时间和凝血酶原时间。哌拉西林钠与肝素、双香豆素、茚满二酮等抗凝血药合用时出血危险增加。与非甾体抗炎药、抗血小板药或磺吡酮与哌拉西林钠合用也可增加出血的危险性。如果出现出血现象须停药并采取相应的治疗措施。哌拉西林钠与溶栓药合用时可能发生严重出血，不宜同时使用。(4) 少量哌拉西林可自乳汁中分泌，可使婴儿致敏、出现腹泻、念珠菌感染和皮疹。尚未获得大量的妊娠和哺乳期妇女使用注射用哌拉西林钠舒巴坦钠的研究资料。因此妊娠及哺乳者应用本品应权衡利弊。(5) 老年患者（> 65 岁）因肾功能可稍减弱，用药量宜酌减。

【禁忌证】对青霉素类、头孢菌素类或 β - 内酰胺酶抑制药过敏或对上述药物有过敏史者禁用。

【不良反应】仅少数患者可能发生：(1) 胃肠道反应：腹泻、稀便、恶心、呕吐，腹胀；假膜性肠炎罕见。(2) 皮肤反应：可能引起皮疹、瘙痒。(3) 变态反应：可引起变态反应，因此，用药前须询问过敏史，有青霉素过敏史者禁用。(4) 局部反应：可引起注射部位局部刺激反应、疼痛、静脉炎、血栓性静脉炎、水肿等。(5) 其他反应：可见头痛、头晕，烦躁、焦虑。

【用法与用量】静脉滴注：使用前，先将本品溶于适量 5% 葡萄糖注射液、0.9% 氯化钠注射液，然后再用同一溶媒稀释至 500 ~ 1 000 ml 滴注，滴注时间为 30 ~ 60 分钟。

【制剂与规格】注射用哌拉西林钠舒巴坦钠：① 1.25 g；② 2.5 g

哌拉西林钠他唑巴坦钠 [保(乙)]

Piperacillin Sodium and Tazobatam

【适应证】(1) 对哌拉西林耐药，但对哌拉西林他唑巴坦敏感的产 β - 内酰胺酶的细菌引起的中、重度感染。如大肠埃希菌和拟杆菌属（脆弱拟杆菌、卵形拟杆菌、多形拟杆菌或普通拟杆菌）所致的阑尾炎（伴发穿孔或脓肿）和腹膜炎；金黄色葡萄球菌所致的中、重度医院获得性肺炎、非复杂性和复杂性皮肤及软组织感染，包括蜂窝织炎、皮肤脓肿、缺血性或糖尿病性足部感染；大肠埃希菌所致的产后子宫内膜炎或盆腔炎性疾病；流感嗜血杆菌所致的社区获得性肺炎（仅限中度）。(2) 敏感细菌所致的全身和（或）局部细菌感染。

【注意事项】(1) 见哌拉西林的注意事项。用药前须做青霉素皮肤试验，阳性者禁用。(2) 哌拉西林钠他唑巴坦钠含钠，需要控制盐摄入量的患者使用时，应定期检查血清电解质水平；对于同时接受细胞毒药或利尿药治疗的患者，要警惕发生低钾血症的可能。(3) 发生抗生素相关性肠炎者应进行粪便检查、艰难梭菌培养以及此菌的细胞毒素分析。(4) 用药期间应定期检查造血功能，特别是对疗程 ≥ 21 日的患者。(5) 现有的临床研究资料表明哌拉西林钠他唑巴坦钠对于医院内下呼吸道感染及复杂性尿路感染的疗效不佳。

【禁忌证】对青霉素类、头孢菌素类抗生素或 β - 内酰胺酶抑制药过敏者禁用。

【不良反应】常见不良反应：①皮肤反应，皮疹、瘙痒等。②消化道反应，如腹泻、恶心、呕吐等。③过敏反应。④局部反应，如注射局部刺激反应、疼痛、静脉炎、血栓性静脉炎和水肿等。⑤其他反应，如血小板减少、胰腺炎、发热、发热伴嗜酸性粒细胞增多、ALT 及 AST 升高等，但这些反应常发生在本品与氨基糖苷类药物联合治疗时。

【用法与用量】(1) 用法：用 20 ml 稀释液（氯化钠注射液或灭菌注射用水）充分溶解后，立即加入 250 ml 液体（5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液）中，静脉滴注，至少 30 分钟，疗程为 7 ~ 10 日。医院获得性肺炎疗程为 7 ~ 14 日。并可根据病情及细菌学检查结果进行调整。(2) 用量：①成人及 12 岁以上儿童，静脉滴注，一次 4.5 g，每 8 小时 1 次；或一次 3.375 g，每 6 小时 1 次。治疗获得

性肺炎时，起始剂量为一次3.375g，每4小时1次，同时合并使用氨基糖苷类药物；如果未分离出铜绿假单胞菌，可根据感染程度及病情考虑停用氨基糖苷类药物。②对于肾功能不全患者的用法见表9-4。③对于血液透析患者，一次最大剂量为2.25g，每8小时1次，并在一次血液透析后追加0.75g。

【制剂与规格】注射用哌拉西林钠他唑巴坦钠：①4.5g（哌拉西林钠4g，他唑巴坦钠0.5g）；②3.375g（哌拉西林钠3g，他唑巴坦钠0.375g）；③2.25g（哌拉西林钠2g，他唑巴坦钠0.25g）；④1.125g（哌拉西林钠1g,他唑巴坦钠0.125g）。

美洛西林[保(乙)]

Mezlocillin

【适应证】用于大肠埃希菌、肠杆菌属、变形杆菌等革兰阴性杆菌中敏感菌株所致的呼吸系统、泌尿系统、消化系统、妇科和生殖器官等感染，如败血症、化脓性脑膜炎、腹膜炎、骨髓炎、皮肤及软组织感染及眼、耳、鼻、喉科感染。

【注意事项】(1)用药前须做青霉素皮肤试验，阳性者禁用。(2)交叉过敏反应：对一种青霉素类抗生素过敏者可能对其他青霉素类抗生素也过敏。也可对青霉胺或头孢菌素类过敏。(3)肾功能减退患者应适当降低用量。(4)下列情况应慎用：有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病史者。(5)对诊断的干扰：①用药期间，以硫酸铜法进行尿糖测定时可出现假阳性，用葡萄糖酶法者则不受影响；②大剂量注射给药可出现高钠血症；③可使血清丙氨酸氨基转移酶或门冬氨酸氨基转移酶升高。(6)应用大剂量时应定期检测血清钠。(7)孕妇及哺乳期妇女用药：美洛西林可透过胎盘屏障进入胎儿血循环，并有少量随乳汁分泌，哺乳期妇女应用本品虽尚无发生严重问题的报告，但孕妇及哺乳期妇女应用仍须权衡利弊，因其应用后可使婴儿致敏和引起腹泻、皮疹、念珠菌属感染等。(8)老年用药：老年患者肾功能减退，须调整剂量。

【禁忌证】对青霉素类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】(1)食欲缺乏、恶心、呕吐、腹泻、肌内注射局部疼痛和皮疹，且多在给药过程中发生，大多程度较轻，不影响继续用药，重者停药后上述症状迅速减轻或消失。(2)少数病例可出现ALT及AST、碱性磷酸酶升高及嗜酸性粒细胞一过性增多。(3)中性粒细胞减少、低钾血症等极为罕见。

【用法与用量】(1)用法：肌内注射、静脉注射或静脉滴注。①肌内注射临用前加注射用水溶解，静脉注射通常加入5%葡萄糖氯化钠注射液或5%～10%葡萄糖注射液溶解后使用。②肌内注射一日2～4次，静脉滴注按需要每6～8小时1次，其剂量根据病情而定，严重者可每4～6小时静脉注射1次。(2)用量：①成人一日2～6g，严重感染者可增至8～12g，最大可增至15g。②儿童，按体重一日0.1～0.2g/kg，严重感染者可增至0.3g/kg。

【制剂与规格】注射用美洛西林钠：①0.5g；②1.0g；③2g；④2.5g；⑤3g；⑥4g。

表9-4 肾功能不全患者哌拉西林钠他唑巴坦的用法

肌酐清除率(ml)	推荐用法与用量		
	一次量(g)	间隔时间(小时)	一日总量(g)(哌拉西林钠/他巴唑坦钠)
每分钟40～90	3.375	6	12/1.5
每分钟20～40	2.25	6	8/1.0
每分钟＜20	2.25	8	6/0.75

阿洛西林[保(乙)]

Azlocillin

【适应证】用于敏感的革兰阳性菌及阴性菌所致的各种感染以及铜绿假单胞菌感染，包括败血症，脑膜炎，心内膜炎，化脓性胸膜炎，腹膜炎及下呼吸道，胃肠道，胆道，泌尿道，骨及软组织和生殖器官等感染，妇科，产科感染，恶性外耳炎，烧伤，皮肤及手术感染等。

【注意事项】(1) ~ (7) 同美洛西林注意事项的 (1) ~ (7)。(8) 静脉滴注时注意速度不宜太快。

【禁忌证】对青霉素类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】(1) 恶心、呕吐、腹泻及抗生素相关性肠炎等胃肠道反应。(2) 皮疹，药物热和哮喘等过敏反应。(3) 贫血，血小板减少，嗜酸性粒细胞增多等。(4) AST 及 ALT 可轻度增高。(5) 由念珠菌或耐药菌引起的二重感染。(6) 偶见兴奋、焦虑、失眠、头晕及行为异常等中枢神经系统症状。

【用法与用量】加入适量 5% 葡萄糖氯化钠注射液或 5% ~ 10% 葡萄糖注射液中，静脉滴注。①成人：一日 6 ~ 10 g，严重病例可增至 10 ~ 16 g，一般分 2 ~ 4 次滴注。②儿童：按体重一日 75 mg/kg，婴儿及新生儿按体重一日 100 mg/kg，分 2 ~ 4 次滴注。

【制剂与规格】注射用阿洛西林钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g；④ 3.0 g。

9.3.2 头孢菌素类

根据抗菌谱、抗菌活性、对 β - 内酰胺酶的稳定性以及肾毒性的不同，目前将头孢菌素分为 4 代。

第一代头孢菌素主要作用于需氧革兰阳性球菌，仅对少数肠杆菌科细菌有一定抗菌活性；常用品种有头孢唑啉和头孢拉定注射剂，口服制剂有头孢拉定、头孢氨苄和头孢羟氨苄等。

第二代头孢菌素对革兰阳性球菌的活性与第一代头孢菌素相仿或略差，对部分肠杆菌科细菌亦具有抗菌活性。常用的注射剂有头孢呋辛和头孢替安，口服制剂有头孢克洛、头孢呋辛酯和头孢丙烯等。

第三代头孢菌素对肠杆菌科细菌有良好抗菌作用，其中头孢他啶和头孢哌酮对铜绿假单胞菌及某些非发酵菌亦有较好作用。注射品种有头孢噻肟、头孢曲松、头孢他啶和头孢哌酮等。口服制剂有头孢克肟、头孢泊肟酯等。

第四代头孢菌素常用者为头孢吡肟，对肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌的活性与头孢他啶大致相仿；但对产头孢菌素酶（AmpC）的阴沟肠杆菌、产气肠杆菌、柠檬酸杆菌和沙雷菌属的作用优于头孢他啶等第三代头孢菌素。

头孢菌素类药物像青霉素类药物那样，可与一些 β - 内酰胺酶抑制药（克拉维酸、舒巴坦、他唑巴坦）组成复方制剂使用。

应用头孢菌素类前应仔细询问患者有否对青霉素类和其他 β - 内酰胺类药物过敏史，有上述药物过敏史者有明确应用头孢菌素类指征时慎用本类药物，有青霉素过敏性休克史者避免应用头孢菌素类。用药前是否进行过敏试验，请遵照该产品说明书。

头孢唑林[基(基)，保(甲)]

Cefazolin

【适应证】(1) 敏感细菌所致的中耳炎、支气管炎、肺炎等呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染、骨和关节感染、败血症、感染性心内膜炎、肝胆系统感染及眼、耳、鼻、咽喉科等感染。(2) 外科手术前的预防用药。

【注意事项】(1) 对青霉素过敏或过敏体质者慎用。(2) 交叉过敏反应：患者对一种头孢菌素或头霉素（cephamycin）过敏者对其他头孢菌素或头霉素也可能过敏。患者对青霉素类、青霉素衍生物或青霉胺过敏者也可能对头孢菌素或头霉素过敏。对青霉素过敏患者应用头孢菌素时临床发生过敏反应者达 5% ~ 7%；如做免疫反应测定时，则青霉素过敏患者对头孢菌素过敏者达 20%。(3) 对诊断的干扰：①约 1% 的用药患者可出现直接和间接 Coombs 试验阳性；②尿糖假阳性反应

（硫酸铜法），用葡萄糖酶法者则不受影响；③可使血清 AST 及 ALT、碱性磷酸酶和血尿素氮升高。如采用 Jaffe 反应进行血清和尿肌酐值测定时可有假性增高。(4) 患者有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎（头孢菌素类很少产生抗生素相关性肠炎）者和患者有肾功能减退者应慎用头孢菌素。(5) 头孢唑林与庆大霉素或其他肾毒性抗生素合用有增加肾损害的危险性；对肾功能减退患者应在减少剂量情况下谨慎使用；因头孢唑林部分在肝脏代谢，因此肝功能损害患者也应慎用。(6) 静脉滴注：将本品用灭菌注射用水、氯化钠注射液或葡萄糖注射液溶解后使用，当静脉滴注体积超过 100 ml 时不要用注射用水。(7) 配制后的药液应避光保存。室温保存不得超过 48 小时。(8) 按照处方或遵医嘱使用。(9) 常温不溶时，可微热至 37℃使其溶解。(10) 孕妇及哺乳期妇女用药：头孢菌素类可经乳汁排出，哺乳期妇女应用本品虽尚无发生问题的报告，但其应用仍须权衡利弊后决定。(11) 儿童用药：早产儿及 1 个月以下的新生儿不推荐应用本品。(12) 老年患者用药：头孢唑林在老年人中血消除半衰期（$t_{1/2}$）较年轻人明显延长，应按肾功能适当减量或延长给药间期。

【禁忌证】对头孢菌素过敏者及有青霉素过敏性休克或即刻反应者禁用。

【不良反应】(1) 静脉注射发生的血栓性静脉炎和肌内注射区疼痛均较头孢噻吩少而轻。(2) 药疹发生率为 1.1%，嗜酸性粒细胞增高的发生率为 1.7%，偶有药物热。(3) 个别患者可出现暂时性 AST 及 ALT、碱性磷酸酶升高。(4) 肾功能减退患者应用高剂量（一日 12 g）的本品时可出现脑病反应。(5) 白色念珠菌二重感染偶见。

【用法与用量】(1) 用法：可静脉缓慢注射、静脉滴注或肌内注射。①肌内注射：临用前加灭菌注射用水或氯化钠注射液溶解后使用。②静脉注射：临用前加适量注射用水完全溶解后于 3 ~ 5 分钟静脉缓慢注射。③静脉滴注：加适量注射用水溶解后，再加入氯化钠或葡萄糖注射液 100 ml 稀释后静脉滴注。(2) 用量：①成人常用剂量：一次 0.5 ~ 1g，一日 2 ~ 4 次，严重感染可增加至一日 6 g，分 2 ~ 4 次静脉给予。②儿童常用剂量：一日 50 ~ 100 mg/kg，分 2 ~ 3 次静脉缓慢注射，静脉滴注或肌内注射。③肾功能减退者按其肌酐清除率调节用量：每分钟大于 50 ml 时，可按正常剂量给药；每分钟 35 ~ 50 ml 时，每 8 小时 0.5 g；为每分钟 11 ~ 34 ml 时，每 12 小时 0.25 g；每分钟小于 10 ml 时，每 18 ~ 24 小时 0.25 g。所有不同程度肾功能减退者的首次剂量为 0.5 g。④小儿肾功能减退者应用头孢唑林时，先给予 12.5 mg/kg，继而按其肌酐清除率调节维持量：每分钟大于 70 ml 时，可按正常剂量给予；每分钟 40 ~ 70 ml 时，每 12 小时按体重 12.5 ~ 30 mg/kg；每分钟 20 ~ 40 ml 时，每 12 小时按体重 3.1 ~ 12.5 mg/kg；每分钟 5 ~ 20 ml 时，每 24 小时按体重 2.5 ~ 10 mg/kg。⑤用于预防外科手术后感染时，一般为术前 0.5 ~ 1 小时肌内注射或静脉给药 1 g，手术时间超过 6 小时者术中加用 0.5 ~ 1 g，术后每 6 ~ 8 小时 0.5 ~ 1 g，至手术后 24 小时止。

【制剂与规格】注射用头孢唑林钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 1.5 g；④ 2.0 g。

头孢拉定 [保（甲／乙）]

Cefradine

【适应证】用于敏感菌所致的急性咽炎、扁桃体炎、中耳炎、支气管炎和肺炎等呼吸道感染、泌尿生殖道感染及皮肤软组织感染等。

【注意事项】(1) 在应用前须详细询问患者对头孢菌素类、青霉素类及其他药物过敏史，有青霉素类药物过敏性休克史者不可应用本品，其他患者应用本品时必须注意头孢菌素类与青霉素类存在交叉过敏反应的概率为 5% ~ 7%，需在严密观察下慎用。一旦发生过敏反应，立即停用药物。如发生过敏性休克，须立即就地抢救，包括保持气道通畅、吸氧和肾上腺素、糖皮质激素的应用等措施。(2) 头孢拉定主要经肾排出，肾功能减退者须减少剂量

或延长给药间期。(3) 应用头孢拉定的患者以硫酸铜法测定尿糖时可出现假阳性反应。(4) 儿童、孕妇及哺乳期妇女慎用，因头孢拉定可透过血-胎盘屏障进入胎儿血循环，孕妇用药需有确切适应证。头孢拉定可少量进入乳汁，虽至今尚无哺乳期妇女应用头孢菌素类发生问题的报告，但应用时仍须权衡利弊。

【禁忌证】对头孢菌素过敏者及有青霉素过敏性休克或即刻反应史者禁用本品。

【不良反应】(1) 恶心、呕吐、腹泻、上腹部不适等胃肠道反应较为常见。(2) 药疹发生率为 1% ~ 3%，抗生素相关性肠炎、嗜酸性粒细胞增多。偶见阴道念珠菌病。(3) 直接 Coombs 试验阳性反应、周围血象白细胞及中性粒细胞减少等见于个别患者。(4) 少数患者可出现暂时性血尿素氮升高，ALT 及 AST、血清碱性磷酸酶一过性升高。(5) 肌内注射疼痛明显，有静脉注射后发生静脉炎的报道。(6) 罕见血尿、精神异常、听力减退、迟发性变态反应、过敏性休克、排尿困难、药物性溶血、心律失常等。

【用法与用量】(1) 用法：口服、静脉滴注、静脉注射或肌内注射。①配制肌内注射用药时，将 2 ml 注射用水加入 0.5 g 装瓶内，须做深部肌内注射。②配制静脉注射液时，将至少 10 ml 注射用水或 5% 葡萄糖注射液分别注入 0.5 g 装瓶内。于 5 分钟内注射完毕。③配制静脉滴注液时，将适宜的稀释液 10 ml 分别注入 0.5 g 装瓶内，然后再以氯化钠注射液或 5% 葡萄糖液作进一步稀释。④干混悬剂加饮用水至瓶上刻度线后摇匀成混悬液，混悬液室温贮放，7 日内服用完；冰箱内贮放，14 日内服用完。(2) 用量：①口服：成人一次 0.25 ~ 0.5 g，每 6 小时 1 次，感染较严重者一次可增至 1.0 g，但一日总量不超过 4 g；儿童按体重一次 6.25~12.5 mg/kg，每 6 小时 1 次。②静脉滴注、静脉注射或肌内注射：成人，一次 0.5 ~ 1.0 g，每 6 小时 1 次，一日最高剂量为 8 g；儿童（1 周岁以上）按体重一次 12.5~25 mg/kg，每 6 小时 1 次；若肌酐清除率每分钟 > 20 ml、5 ~ 20 ml 或 < 5 ml 时，剂量宜分别调整为每 6 小时 0.5 g、每 6 小时 0.25 g 和每 12 小时 0.25 g。

【制剂与规格】头孢拉定胶囊：① 0.25 g；② 0.5 g。

头孢拉定干混悬剂：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 1.5 g；④ 3 g。

头孢拉定片：① 0.25g；② 0.5g。

头孢拉定颗粒：① 0.125g；② 0.25g。

注射用头孢拉定：① 0.5g；② 1.0g。

头孢氨苄 [基（基）、保（甲）]

Cefalexin

【适应证】用于金黄色葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎球菌、大肠埃希菌、肺炎杆菌、流感杆菌、痢疾杆菌等敏感菌株引起的下列部位的轻、中度感染。①扁桃体炎、扁桃体周炎、咽喉炎、支气管炎、肺炎、支气管肺炎、哮喘和支气管扩张感染以及手术后胸腔感染。②急性及慢性肾盂肾炎、膀胱炎、前列腺炎及泌尿生殖系感染。③中耳炎、外耳炎、鼻窦炎。④上颌骨周炎、上颌骨骨膜炎、上颌骨骨髓炎、急性腭炎、牙槽脓肿、根尖性牙周炎、智齿周围炎、拔牙后感染。⑤睑腺炎、眼睑炎、急性泪囊炎。⑥毛囊炎、疖、丹毒、蜂窝织炎、脓疱、痈、痤疮感染、皮下脓肿、创伤感染、乳腺炎、淋巴管炎等。

【注意事项】(1) 在应用前须详细询问患者对头孢菌素类、青霉素类及其他药物过敏史，有青霉素类药物过敏性休克史者不可应用，其他患者应用时必须注意头孢菌素类与青霉素类存在交叉过敏反应的概率为 5% ~ 7%，需在严密观察下慎用。一旦发生过敏反应，立即停用药物。如发生过敏性休克，须立即就地抢救，包括保持气道通畅、吸氧和肾上腺素、糖皮质激素的应用等措施。(2) 有胃肠道疾病史的患者，尤其有溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗菌药物相关性结肠炎（头孢菌素很少产生抗生素相关性肠炎）者以及肾功能减退者应慎用。(3) 对诊断的干扰：应用头孢氨苄时可出现直接 Coombs 试验阳性反应和尿糖假阳性反应（硫酸铜法）；少数患者的碱性磷酸酶、血清丙氨酸氨基转移酶和门冬氨酸氨基转移酶皆可升高。

(4) 当每日口服剂量超过4 g时，应考虑改用注射用头孢菌素类药物。(5) 头孢氨苄主要经肾排出，肾功能减退患者应用须减量。(6) 孕妇及哺乳期妇女用药：头孢氨苄可透过胎盘，故孕妇应慎用；头孢氨苄可经乳汁排出，虽至今尚无哺乳期妇女应用头孢菌素类发生问题的报道，但其应用仍须权衡利弊后应用。

【禁忌证】对头孢菌素过敏者及有青霉素过敏性休克或即刻反应史者禁用。

【不良反应】(1) 恶心、呕吐、腹泻和腹部不适较为多见。(2) 皮疹、药物热等过敏反应。偶可发生过敏性休克。(3) 头晕、复视、耳鸣、抽搐等神经系统反应。(4) 应用期间偶有出现肾损害。(5) 偶有患者出现AST及ALT升高、Coombs试验阳性。溶血性贫血罕见，中性粒细胞减少和抗生素相关性肠炎也有报告。

【用法与用量】口服：(1) 片剂、颗粒剂、干混悬剂、胶囊剂。①成人剂量：口服，一般一次250 ~ 500 mg，一日4次，最高剂量一日4 g。单纯性膀胱炎、皮肤软组织感染及链球菌咽峡炎患者每12小时500 mg。②儿童剂量：口服，一日按体重25 ~ 50 mg/kg，一日4次。皮肤软组织感染及链球菌咽峡炎患者，一次12.5 ~ 50 mg/kg，一日2次。③肾功能减退的患者，应根据肾功能减退的程度，减量用药。(2) 缓释胶囊：①成年人及体重20 kg以上儿童，常用量一日1 ~ 2 g，分2次于早、晚餐后口服。② 20 kg体重以下儿童，一日40 ~ 60 mg/kg，分2次于早、晚餐后口服。

【制剂与规格】头孢氨苄胶囊：① 0.125 g；② 0.25 g。

头孢氨苄干悬混剂：1.5 g。

头孢氨苄片：① 0.125 g；② 0.25 g。

头孢氨苄颗粒：① 50 mg；② 125 mg。

头孢氨苄缓释胶囊：0.25 g。

头孢氨苄泡腾片：0.125 g。

头孢羟氨苄[保(乙)]

Cefadroxil

【适应证】用于敏感细菌所致的尿路感染、皮肤软组织感染以及急性扁桃体炎、急性咽炎、中耳炎和肺部感染等。

【注意事项】(1) ~ (5) 同头孢氨苄注意事项的 (1) ~ (5)。(6) 孕妇及哺乳期妇女用药：孕妇用药需有确切适应证。本品亦可进入乳汁，虽至今尚无哺乳期妇女应用头孢菌素类发生问题的报道，但仍须权衡利弊后应用。

【禁忌证】对有头孢菌素类药物过敏史者和有青霉素过敏性休克史者或即刻反应史者禁用。

【不良反应】(1) 以恶心、上腹部不适等胃肠道反应为主。(2) 少数患者尚可发生皮疹等过敏反应，偶可发生过敏性休克。(3) 也可出现尿素氮、AST及ALT、血清碱性磷酸酶一过性升高。其他见头孢唑林。

【用法与用量】口服：(1) 胶囊剂、片剂：①成人：一次0.5 ~ 1.0 g，一日2次。②儿童：一次15 ~ 20 mg/kg，一日2次；A组溶血性链球菌咽炎及扁桃体炎每12小时15 mg/kg；疗程至少10日。③成人肾功能减退者首次剂量为1 g饱和量，然后根据肾功能减退程度予以延长给药间期。肌酐清除率为每分钟25 ~ 50 ml、10 ~ 24 ml和0 ~ 9 ml时，分别每12小时、24小时和36小时服药500 mg。(2) 颗粒剂：溶于40℃以下的温开水内口服。①成人：一日1 ~ 2 g，分2 ~ 3次服；②小儿一日30 mg/kg体重，分2次服。或遵医嘱。

【制剂与规格】头孢羟氨苄胶囊：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5 g。

头孢羟氨苄片：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5 g。

头孢羟氨苄颗粒：① 0.125 g；② 0.25 g。

头孢硫脒[保(乙)]

Cefathiamidine

【适应证】用于敏感菌所引起的呼吸系统、肝胆系统、五官、尿路感染及心内膜炎、败血症。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应：用前须详细询问头孢菌素类及青霉素类药过敏史，对一种头孢菌素或头霉素过敏者对其他头孢菌素或头霉素也可能过敏。对青霉素类、青霉素衍生物或青霉胺过敏者也可能对头孢菌素或头霉素过敏。(2) 对青

霉素过敏患者应用本品时应根据患者情况充分权衡利弊后决定。(3) 有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎者应慎用。(4) 肾功能减退患者应用本品须适当减量。(5) 对诊断的干扰：应用本品的患者抗球蛋白试验可出现阳性；孕妇产前应用本品，此阳性反应也可出现于新生儿。(6) 妊娠初始期妇女慎用。哺乳期妇女应用头孢菌素类虽尚未见发生问题的报道，其应用仍须权衡利弊。(7) 老年患者肾功能减退，应用时须适当减量。

【禁忌证】对头孢菌素类抗生素过敏者或对青霉素过敏性休克者禁用。

【不良反应】偶见荨麻疹、哮喘、瘙痒、寒战、高热、血管神经性水肿、非蛋白氮、ALT 及 AST 升高。

【用法与用量】(1) 肌内注射：成人一次 0.5 ~ 1.0 g，一日 4 次；儿童按体重一日 50 ~ 100 mg/kg，分 3 ~ 4 次给药。(2) 静脉注射：成人一次 2 g，一日 2 ~ 4 次；儿童按体重一日 50 ~ 100 mg/kg，分 2 ~ 4 次给药。用前加灭菌注射用水或氯化钠注射液适量溶解。

【制剂与规格】注射用头孢硫脒：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

头孢呋辛 [基(基)，保(甲)]

Cefuroxime

【适应证】用于敏感细菌所致的下列感染。①呼吸道感染：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌（含氨苄西林耐药菌）、克雷伯杆菌属、金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）、化脓性链球菌及大肠埃希菌所引起的呼吸道感染，如中耳炎、鼻窦炎、扁桃体炎、咽炎和急、慢性支气管炎、支气管扩张合并感染、细菌性肺炎、肺脓肿和术后肺部感染。②泌尿道感染：由大肠埃希菌及克雷伯杆菌属细菌所致的尿道感染，如肾盂肾炎、膀胱炎和无症状性菌尿症。③皮肤及软组织感染：由金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）、化脓性链球菌、大肠埃希菌、克雷伯杆菌属及肠道杆菌属细菌所致的皮肤及软组织感染，如蜂窝织炎、丹毒、腹膜炎及创伤感染。④败血症：由金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）、肺炎链球菌大肠埃希菌、流感嗜血杆菌（含氨苄西林耐药菌）及克雷伯杆菌属细菌所引起的败血症。⑤脑膜炎：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌（含氨苄西林耐药菌）、脑膜炎奈瑟菌及金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）所引起的脑膜炎。⑥淋病：由淋病奈瑟菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）所引起的单纯性（无并发症）及有并发症的淋病，尤其适用于不宜用青霉素治疗者。⑦骨及关节感染：由金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）所引起的骨及关节感染。⑧可用于术前或术中防止敏感致病菌的生长，减少术中及术后因污染引起的感染。如腹部骨盆及矫形外科手术、心脏、肺部、食管及血管手术、全关节置换手术中的预防感染。

【注意事项】(1) 对青霉素类药物过敏者，慎用。(2) 使用时应注意监测肾功能，特别是对接受高剂量的重症患者。(3) 肾功能不全者应减少一日剂量。(4) 头孢呋辛能引起抗生素相关性肠炎，应警惕。抗生素相关性肠炎诊断确立后，应给予适宜的治疗。轻度者停药即可，中、重度者应给予液体、电解质、蛋白质补充，并需选用对梭状芽胞杆菌有效的抗生素类药物治疗。(5) 有报道少数患儿使用本品时出现轻、中度听力受损。(6) 相容性和稳定性：①肌内注射：用灭菌注射用水配制时，在室温 24 小时，冰箱 5℃保存 48 小时可保持活性。过了这个期限，任何未用的溶液都应丢弃。②静脉注射：用灭菌注射用水配制时，0.75 g、1.5 g 配制后的溶液在室温 24 小时，冰箱 5℃保存 48 小时可保持活性。③在室温下与以下一些溶液可以 24 小时内保持相容性，肝素（10 ~ 50 U/ml）、氯化钾（10 ~ 40 mEq/L）、碳酸氢钠、0.9% 氯化钠。④ 0.75 g 和 1.5 g 本品，用 50 ml 或 100 ml 5% 葡萄糖注射液、0.9% 氯化钠注射液、0.45% 氯化钠注射液稀释，可以在室温存放 24 小时，冰箱存放 7 日。(7) 孕妇及哺乳期妇女用药：孕妇应权衡利弊。本品能在乳汁分泌，哺乳期妇女慎用。(8) 儿童用药：有报道

新生儿对头孢菌素有蓄积作用，3个月以下儿童的安全有效性尚未确定，因而，不推荐使用。

【禁忌证】对头孢菌素类药物过敏者禁用本品。

【不良反应】(1) 局部反应：如血栓性静脉炎等。(2) 胃肠道反应：如腹泻，恶心、抗生素相关性肠炎等。(3) 过敏反应：常见为皮疹、瘙痒、荨麻疹等。偶见过敏症、药物热、多形性红斑、间质性肾炎、毒性表皮剥脱性皮炎、Steves-Johnson综合征。(4) 血液：可见血红蛋白和血细胞比容减少、短暂性嗜酸性粒细胞增多症、短暂性的嗜中性白细胞减少症及白细胞减少症等，偶见血小板减少症。(5) 肝功能：可见ALT及AST、碱性磷酸酶、乳酸脱氢酶及血清胆红素一过性升高。(6) 其他：尚见呕吐、腹痛、结肠炎、阴道炎（包括阴道念珠球菌病），肝功能异常（包括胆汁淤积），再生障碍性贫血，溶血性贫血，出血，引发癫痫，凝血酶原时间延长，各类血细胞减少，粒细胞缺乏症等。

【用法与用量】(1) 深部肌内注射：①肌内注射前，必须回抽无血才可注射。②肌内注射时每0.25g用10ml无菌注射用水溶解，缓慢摇匀得混悬液后，方可深部肌内注射。(2) 静脉注射或滴注：静脉注射每0.25g至少用2.0ml无菌注射用水溶解。摇匀后再缓慢静脉注射，也可加入静脉输注管内滴注。(3) 用量：①成人常用量为每8小时0.75～1.5g，疗程5～10日。对于生命受到威胁的感染或罕见敏感菌所引起的感染，每6小时1.5g。对于细菌性脑膜炎，剂量每8小时不超过3.0g。对于单纯性淋病应肌内注射单剂量1.5g，可分注于两侧臀部，同时口服1g丙磺舒。②预防手术感染：术前0.5～1小时静脉注射1.5g，若手术时间过长，则每隔8小时静脉或肌内注射0.75g。若为开胸手术应随着麻醉药的引入，静脉注射1.5g．以后每隔12小时1次，总剂量为6g。③儿童：3个月以上的患儿，按体重一日50～100mg/kg，分3～4次给药。重症感染，按体重一日用量不低于0.1g/kg，但不能超过成人使用的最高剂量。骨和关节感染，按体重一日0.15g/kg（不超过成人使用的最高剂量），分3次给药。脑膜炎患者按体重一日0.2～0.24g/kg，分3～4次给药。④肾功能不全患者应根据肌酐清除率调整：每分钟＞20ml时，每8小时0.75～1.5g；每分钟10～20ml时，每12小时0.75g；每分钟＜10ml时，每24小时0.75g。肾功能不全的患儿，应参照肾功能不全成人患者用药量进行调整。

【制剂与规格】注射用头孢呋辛钠：①0.25g；②0.5g；③0.75g；④1.0g；⑤1.5g；⑥2.0g；⑦2.25g；⑧2.5g；⑨3.0g。

头孢呋辛酯

Cefuroxime Axetil

【适应证】用于溶血性链球菌、金黄色葡萄球菌（耐甲氧西林株除外）及流感嗜血杆菌、大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌、奇异变形杆菌等肠杆菌科细菌敏感菌株所致的感染。①成人：急性咽炎或扁桃体炎、急性中耳炎、上颌窦炎、慢性支气管炎急性发作、急性支气管炎、单纯性尿路感染、皮肤软组织感染及无并发症淋病奈瑟菌性尿道炎和宫颈炎。②儿童：咽炎或扁桃体炎、急性中耳炎及脓疱病等。

【注意事项】(1) 头孢呋辛酯与青霉素类或头霉素类有交叉过敏反应，因此对青霉素类、青霉素衍生物、青霉胺及头霉素类过敏者慎用。(2) 肾功能减退及肝功能损害者慎用。(3) 有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎者慎用。(4) 长期服用可致菌群失调，引发继发性感染。如发生轻度抗生素相关性肠炎，停药即可，但对于中、重度抗生素相关性肠炎患者，须对症处理并给予抗艰难梭菌的抗菌药物。(5) 应于餐后服用，以增加吸收，提高血药浓度，并减少胃肠道反应。(6) 片剂、胶囊剂不宜压碎后使用，应整片吞服，因此，5岁以下小儿禁用胶囊剂、片剂，宜服用头孢呋辛酯干混悬液。(7) 对实验室检查指标的干扰：①抗球蛋白（Coombs）试验可出现阳性；②硫酸铜尿糖试验可呈假阳性，但葡萄糖酶试验法不受影响；③高铁氰化物血糖试验可呈假阴性，但葡萄糖

酶试验法和抗坏血酸氧化酶试验法不受影响；④血清丙氨酸氨基转移酶、门冬氨酸氨基转移酶、碱性磷酸酶和血尿素氮可升高；⑤采用 Jaffe 反应进行血清和尿肌酐值测定时可有假性增高。(8) 孕妇及哺乳期妇女用药：①动物实验中未发现对胎儿的有害证据，但在人类研究中缺乏足够的资料，因此仅在有明确指征时，孕妇方可慎用；②头孢呋辛酯可经乳汁排出，故哺乳期妇女应慎用或暂停哺乳。(9) 老年用药：85 岁以上的老年患者的血浆消除半衰期可延至约 3.5 小时，因此应在医生指导下根据肾功能情况调整用药剂量或用药间期。(10) 本品应贮放于不超过 30℃的环境内。

【禁忌证】对本品及其他头孢菌素类过敏者、有青霉素过敏性休克或即刻反应史者及胃肠道吸收障碍者禁用。

【不良反应】(1) 常见腹泻、恶心和呕吐等胃肠反应。(2) 少见皮疹、药物热等过敏反应。(3) 偶见抗生素相关性肠炎、嗜酸性粒细胞增多、血胆红素升高、血红蛋白降低、肾功能改变、Coombs 试验阳性和一过性肝酶升高。

【用法与用量】口服：(1) 成人：一日 0.5 g；下呼吸道感染，一日 1 g；单纯性下尿路感染，一日 0.25 g。均分 2 次服用。单纯性淋球菌尿道炎单剂疗法剂量为 1 g。(2) 儿童：小儿急性咽炎或急性扁桃体炎，按体重一日 20 mg/kg，分 2 次服用，一日不超过 0.5 g；急性中耳炎、脓疱病，按体重一日 30 mg/kg，分 2 次服用，一日不超过 1 g。(3) 对注射头孢呋辛钠治疗获得一定疗效，尚需继续治疗的患者，可改为口服本品治疗。(4) 分散片可加入适量温开水中搅拌均匀后服用。

【制剂与规格】头孢呋辛酯片：① 0.125 g；② 0.25 g。

头孢呋辛酯干混悬液：0.125 g。

头孢呋辛酯胶囊：0.125 g。

头孢克洛 [保(乙)]

Cefaclor

【适应证】用于敏感菌株引起的感染。(1) 中耳炎：由肺炎双球菌、流感嗜血杆菌、葡萄球菌、化脓性链球菌（A 组 β 溶血性链球菌）和卡他莫拉菌引起。(2) 下呼吸道感染（包括肺炎）：由肺炎双球菌、流感嗜血杆菌、化脓性链球菌（A 组 β 溶血性链球菌）和卡他莫拉菌引起。(3) 上呼吸道感染（包括咽炎和扁桃体炎）：由化脓性链球菌（A 组 β 溶血性链球菌）和卡他莫拉菌引起。(4) 尿道感染（包括肾盂肾炎和膀胱炎）：由大肠埃希菌、奇异变形杆菌、克雷伯杆菌属和凝固酶阴性的葡萄球菌引起。(5) 皮肤和皮肤组织感染：由金黄色葡萄球菌和化脓性链球菌（A 组 β 溶血性链球菌）引起。(6) 鼻窦炎。(7) 淋球菌性尿道炎：应进行适当的组织培养和敏感性研究，以测定致病菌对头孢克洛的敏感性。

【注意事项】(1) 一般注意事项：长期使用的患者应细心观察，如发生二重感染，必须采取适当措施。(2) 用头孢菌素类抗生素治疗期间，Coombs 试验呈直接阳性。在血液学研究或在输血的交叉配血过程中（当进行抗球蛋白试验时）或对其母亲在分娩前服过头孢菌素的新生儿进行 Coombs 试验，呈阳性可能与药物有关。(3) 存在严重肾功能不全时要慎用，因本品在无尿症患者体内的半衰期为 2.3 ~ 2.8 小时。对于中度至严重肾功能受损患者，应进行仔细的临床和实验室监测。(4) 对于有胃肠道病史（特别是结肠炎）的患者、使用抗生素（包括头孢菌素）要慎重。(5) 在使用前，要注意确定患者以前是否对其他头孢菌素、青霉素或其他药物过敏。如果用于对青霉素过敏患者，要加以注意，因为在 β-内酰胺类抗生素中会产生交叉过敏（包括过敏反应）。(6) 如果发生过敏反应，应立即停药。如果有必要，应使用适当的药物（例如抗组胺药或皮质激素类药）来治疗。(7) 对于显示某种类型过敏（尤其对药物）的患者，应慎用。(8) 使用过程中若发生腹泻，应考虑到会产生抗生素相关性肠炎。轻微者，常停药即可，中度至严重病例，应采取适当治疗。(9) 对孕妇尚无适当的临床研究，除非急需，孕期不宜使用。(10) 哺乳妇女一次口服 500 mg 后，在母乳中可测出少量的头孢克洛，故哺乳妇女慎用。

【禁忌证】禁用于已知对头孢菌素类过敏者。

【不良反应】(1) 过敏反应：①约占患者的1.5%，包括荨麻疹样皮疹（1%）。瘙痒、荨麻疹和Coombs试验阳性，发生率均在0.5%以下。②血清病样反应，这种反应的特点是出现多形性红斑、皮疹及其他伴有关节炎／关节痛的皮肤表现，发热或无发热。与典型的血清病不同之处在于很少与淋巴结病和蛋白尿有关，没有进入循环的免疫复合物，并且无反应后遗症的迹象。常常发生于头孢克洛第二疗程期间或正在进入第二疗程时，儿童比成年人更常发生此类反应，未见有严重后遗症的报道。③罕见Stevens-Johnson综合征、毒性上皮坏死溶解和过敏症。④有青霉素过敏史的患者，可能更常发生过敏反应。(2) 胃肠道综合征：发生率约2.5%，其中包括腹泻。在治疗期间或之后有出现抗生素相关性肠炎综合征的报告。(3) 暂时性肝炎和胆汁淤积性黄疸，罕见。(4) 其他：嗜酸性粒细胞增多、生殖器瘙痒或阴道炎，罕见血小板减少或可逆性间质性肾炎。(5) 罕见中枢神经系统不良反应：神经过敏、失眠、精神错乱、高血压、头晕、幻觉和嗜睡。(6) 临床实验室试验结果存在暂时异常值。AST，ALT或碱性磷酸酶值稍微升高。(7) 造血系统：可引起短暂性淋巴细胞增多、白细胞减少。罕见引起溶血性贫血、再障性贫血、粒细胞缺乏症和可能有临床重要性的可逆性中性粒细胞减少。(8) 肾脏：BUN或血清肌酐水平稍微升高或尿分析异常（人数不到0.5%）。

【用法与用量】口服：(1) 成人：①常用剂量是0.25 g，每8小时1次。②支气管炎和肺炎的剂量是1次0.25 g，一日3次。③鼻窦炎推荐剂量为一次0.25 g、一日3次，共10日。④较重的感染（如肺炎）或敏感性稍差的细菌引起的感染、剂量可加倍，但一日总量不宜超过4 g，可连服28日。⑤治疗男性和女性急性淋球菌尿道炎、可给予一次3 g的剂量，与丙磺舒合用。(2) 儿童：①常用剂量：一日20～40 mg/kg，分3次口服。②轻微的尿路感染、中耳炎，剂量应为一日20 mg/kg，分2～3次。③严重感染，如严重的中耳炎或严重的细菌感染，剂量应为一日40 mg/kg，分3次口服。6岁或6岁以下儿童一日最大剂量不宜超过1 g。

【制剂与规格】头孢克洛片：0.25 g。

头孢克洛分散片：① 0.125 g；② 0.375 g。

头孢克洛胶囊：① 0.125 g；② 0.25 g。

头孢克洛缓释片：0.375 g。

头孢克洛缓释胶囊：0.187 5 g。

头孢克洛颗粒：① 0.1 g；② 0.125 g；③ 0.25 g。

头孢克洛混悬剂：① 0.125 g/5 ml；② 25 mg/ml。

头孢替安[保(乙)]

Cefotiam

【适应证】用于敏感菌所致的肺炎、支气管炎、胆道感染、腹膜炎、尿路感染以及手术和外伤所致的感染和败血症等。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应：对一种头孢菌素或头霉素过敏者对其他头孢菌素或头霉素也可能过敏。对青霉素类、青霉素衍生物或青霉胺过敏者也可能对头孢菌素或头霉素过敏。(2) 有青霉素过敏性休克或即刻反应者，不宜再选用头孢菌素类。(3) 有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎者慎用。(4) 肾功能不全者应减量并慎用。用药期间应进行尿液化验，如果损及肾功能，则应停药。(5) 本品可引起血象改变，严重时应立即停药。(6) 本品溶解后应立即使用，否则药液色泽会变深。(7) 对诊断的干扰：使用本品期间，用碱性酒石酸铜试液进行尿糖实验时，可有假阳性反应；直接抗球蛋白（Coombs）试验可出现假阳性反应。

【禁忌证】对头孢菌素类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】偶见过敏、胃肠道反应、血象改变及一过性AST及ALT升高。可致肠道菌群改变，造成维生素B和K缺乏。偶可致继发感染。大量静脉注射可致血管疼痛和血栓性静脉炎。

【用法与用量】肌内注射、静脉注射或静脉注射。(1) 肌内注射：用0.25%

利多卡因注射液溶解后做深部肌内注射。(2) 静脉注射：用灭菌注射用水、氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液溶解，每0.5 g药物稀释成约20 ml，缓缓注射。(3) 静脉滴注：将1次用量溶于适量的5%葡萄糖注射液、氯化钠注射液或氨基酸输液中，于30分钟内滴入。(4) 成人，一日1～2g，分2～4次给予。严重感染，如败血症也可用至一日4g。(5) 儿童，按体重一日40～80 mg/kg，严重感染可增至一日160 mg/kg，分3～4次给予。

【制剂与规格】注射用盐酸头孢替安：① 0.5 g；② 1 g。

头孢西丁[保(乙)]

Cefoxitin

【适应证】对本品敏感的细菌引起的下列感染：上、下呼吸道感染，泌尿道感染（包括无并发症的淋病），腹膜炎及其他腹腔内、盆腔内感染，败血症（包括伤寒），妇科感染，骨、关节软组织感染，心内膜炎，特别是适用需氧及厌氧菌混合感染，以及对于由产 β－内酰胺酶而对本品敏感细菌引起的感染。

【注意事项】(1) 青霉素过敏者慎用。(2) 肾功能损害者及有胃肠疾病史（特别是结肠炎）者慎用。(3) 本品与氨基糖苷类抗生素配伍时，会增加肾毒性。

【禁忌证】对本品及头孢菌素类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】最常见的为局部反应，静脉注射后可出现血栓性静脉炎，肌内注射后可有局部硬结压痛。偶见的为变态反应（皮疹、瘙痒、嗜酸性粒细胞增多、发热、呼吸困难等）、低血压、腹泻、恶心、呕吐、白细胞减少、血小板减少、贫血以及 ALT、AST、ALP、LDH、BUN 或血清 Cr 值一过性升高。

【用法与用量】肌内注射、静脉注射或静脉滴注：成人一次1～2g，每6～8小时1次。或根据致病菌的敏感程度及病情调整剂量。①单纯性感染（肺炎、泌尿系感染、皮肤感染），一日3～4g，每6～8小时1g，肌内注射或静脉滴注。②中、重度感染，一日6～8g，每4小时1g或6～8小时2g，静脉滴注。③需大剂量抗生素治疗的感染（例如气性坏疽），一日12g，每4小时2g或6小时3g，静脉滴注。④肾功能不全者则需按肌酐清除率调整剂量，按表9-5进行。本品用于肌内注射，每克溶于0.5%盐酸利多卡因注射液2 ml。静脉注射时，每克溶于10 ml无菌注射用水。静脉滴注时，每1～2g溶于50 ml或100 ml氯化钠注射液或5%或10%葡萄糖注射液中。

表 9-5 肾功能不全者调整头孢西丁剂量表

肌酐清除率（毫升／分钟）	一次剂量(g)	用药次数
50～30	1～2	8～12小时1次
29～10	1～2	12～24小时1次
9～5	0.5～1	12～24小时1次
<5	0.5～1	24～48小时1次

【制剂与规格】注射用头孢西丁钠：① 1 g；② 2 g。

头孢地尼[保(乙)]

Cefdinir

【适应证】用于对本品敏感的葡萄球菌属、链球菌属、肺炎球菌、消化链球菌、丙酸杆菌、淋病奈瑟菌、卡他莫拉菌、大肠埃希菌、克雷伯菌属、奇异变形杆菌、普鲁威登斯菌属、流感嗜血杆菌等菌株所引起的下列感染：咽喉炎、扁桃体炎、急性支气管炎、肺炎、中耳炎、鼻窦炎、肾盂肾炎、膀胱炎、淋菌性尿道炎、附件炎、宫内感染、前庭大腺炎、乳腺炎、肛门周围脓肿、外伤或手术伤口的继发感染、毛囊炎、疖、疖肿、痈、传染性脓疱病、丹毒、蜂窝织炎、淋巴管炎、甲沟炎、皮下脓肿、粉瘤感染、慢性脓皮症、眼睑炎、睑腺炎、睑板腺炎等。

【注意事项】(1) 因有出现休克等过敏反应的可能，应详细询问过敏史。(2) 下列患者应慎重使用：对青霉素类抗生素有过敏史者；本人或亲属中有易发生支气管哮喘、皮疹、荨麻疹等过敏症状体质者；严重的肾功能障碍者；患有严重基础疾病、不能很好进食或非经口摄取营养者、高龄者、恶病质等患者。(3) 可能出现红色尿。(4) 对孕妇或怀疑有妊娠的妇女及哺乳期

妇女，用药要权衡利弊。(5) 老年患者使用本品时应特别注意由于身体功能下降，老年患者可能容易出现不良反应以及由于维生素 K 缺乏，老年患者可能会有出血倾向，应根据对患者的临床观察调整剂量和给药间隔。

【禁忌证】对本品有休克史者禁用。对青霉素或头孢菌素有过敏史者慎用。

【不良反应】常见腹泻、腹痛、皮疹、瘙痒、AST 及 ALT 升高；其他尚可能发生史-约综合征或毒性表皮坏死松懈症、发生变态反应、休克、血细胞减少症、粒细胞缺乏症、血小板减少症或溶血性贫血、严重的结肠炎、发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 线检查异常或嗜酸粒细胞增多证实的间质性肺炎或 PIE 综合征，急性肾衰竭、严重肝炎等。

【用法与用量】口服：成人一次 100 mg，一日 3 次。儿童一日 9 ~ 18 mg/kg，分 3 次口服。可依年龄、症状进行适量增减。

【制剂与规格】头孢地尼分散片：① 50 mg；② 0.1 g。

拉氧头孢[保(乙)]

Latamoxef

【适应证】用于敏感致病菌所引起的中重度感染：如败血症、感染症心内膜炎、外伤与手术伤口等继发性感染、肺炎、扁桃体周围脓肿、脓胸、支气管炎、支气管扩张症继发感染、慢性呼吸道疾病急性发作感染、肾盂肾炎、膀胱炎、前列腺炎、淋菌性尿道炎；胆囊炎、胆管炎、腹膜炎、骨盆腹膜炎、脓肿、子宫附属器官炎、子宫内膜炎、骨盆腔炎、子宫旁组织炎、前庭大腺炎等。

【注意事项】(1) 对青霉素有过敏史者、妊娠及哺乳期妇女、肾功能损害者慎用。(2) 大量静脉注射应选择合适部位，缓慢注射，以减轻对管壁的刺激及减少静脉炎的发生。

【禁忌证】对本品过敏者禁用

【不良反应】常见皮疹、荨麻疹、瘙痒、恶心、呕吐、腹泻、腹痛等；少见过敏性休克；偶见 AST 及 ALT 升高，停药后均可自行消失。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：滴注时间至少要 30 分钟以上。在静脉注射用 0.5 g 及 1 g 的 10 ml 容量瓶中加入 4 ml 以上注射用水和 5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液充分振荡溶解。成人，一日 1 ~ 2 g，一日 2 次（每 12 小时）；对于难治性或重症感染，成人可增量到一日 4 g，分 2 ~ 4 次给药。儿童，一日 60 ~ 80 mg/kg，分 3 ~ 4 次给药。早产儿、新生儿，一次 20 mg/kg；出生后 3 日内一日分 2 ~ 3 次，4 日以后一日分 3 ~ 4 次给药。可依年龄、症状适当增减。早产儿、新生儿、儿童可增量到一日 150 mg/kg，分 3 ~ 4 次给药。血液透析患者透析开始时 1 g，透析终了时 1 g（可推荐）；持续的门诊腹膜透析法患者，一日 1 次，一次 1 g。

【制剂与规格】注射用拉氧头孢钠：① 1 g；② 2 g。

头孢米诺[保(乙)]

Cefminox

【适应证】用于治疗敏感细菌引起的感染：①呼吸系统感染：扁桃体炎、扁桃体周围脓肿、支气管炎、细支气管炎、支气管扩张症（感染时）、慢性呼吸道疾患继发感染、肺炎、肺化脓症；②泌尿系统感染：肾盂肾炎、膀胱炎；③腹腔感染：胆囊炎、胆管炎、腹膜炎；④盆腔感染：盆腔腹膜炎、子宫附件炎、子宫内感染、盆腔死腔炎、子宫旁组织炎；⑤败血症。

【注意事项】(1) 本品可能引起过敏性休克，使用前应仔细问诊，如欲使用，应进行皮试。做好休克急救准备，给药后注意观察。(2) 对 β-内酰胺类抗生素有过敏史的患者慎用。(3) 本人或双亲、兄弟为支气管哮喘、皮疹、荨麻疹等过敏体质者慎用。(4) 肾功能不全者可调整剂量使用，严重肾功能损害患者慎用。(5) 老年患者有可能出现维生素 K 缺乏引起的出血倾向。(6) 饮酒可能引起颜面潮红、心悸、眩晕、头痛、恶心等，故用药期间及用药后至少 1 周避免饮酒。(7) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(8) 新生儿、早产儿用药安全性尚未确立；满月后的小儿可参照体重用药。

【禁忌证】对头孢米诺或头孢烯类抗生素过敏的患者禁用。

【不良反应】(1) 严重不良反应：休克、全血细胞减少症、假膜性肠炎、皮肤黏膜眼综合征、中毒性表皮坏死症、急性肾衰竭、溶血性贫血、间质性肺炎、PIE 综合征、变态反应（如皮疹、发红、瘙痒、发热等）、BUN 上升、血肌酐升高、少尿、蛋白尿等。(2)有时发生的不良反应：粒细胞减少、嗜酸性粒细胞增多，偶见红细胞减少、血细胞比容值降低、血红蛋白减少、血小板减少、凝血酶原时间延长、ALT 及 AST、ALP、γ-GTP、LAP、LDH、胆红素升高、腹泻、恶心、呕吐、食欲减退、口内炎、念珠菌病、维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原血症、出血倾向等）、维生素 B 缺乏症（舌炎、口内炎、食欲减退、神经炎等）、全身乏力感。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：①静脉注射：每 1 g 可用 20 ml 灭菌注射用水、5% ~ 10% 葡萄糖注射液或 0.9% 氯化钠注射液溶解。②静脉滴注：每 1g 可用 100 ~ 500 ml 的 5% ~ 10% 葡萄糖注射液或 0.9% 氯化钠注射液溶解，滴注 1 ~ 2 小时。本品应临用时配制，溶解后尽快使用。成人，每次 1 g，一日 2 次，可随年龄及症状适当增减；对于败血症、难治性或重症感染症，1 日可增至 6 g，分 3 ~ 4 次给药。儿童，按体重计每次 20 mg/kg，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】注射用头孢米诺钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 1.5 g；④ 2.0 g。

头孢唑肟 [保（乙）]

Ceftizoxime

【适应证】用于敏感细菌所致的下呼吸道、尿路、腹腔、盆腔、皮肤与软组织、骨与关节感染、败血症、肺炎链球菌或流感嗜血杆菌所致脑膜炎和淋球菌所致的单纯性淋病。

【注意事项】(1) 用前须详细询问患者曾有否对本品、其他头孢菌素类、青霉素类或其他药物的过敏史。因此有青霉素类过敏史患者，有指征应用本品时，必须充分权衡利弊后在严密观察下慎用。如以往发生过青霉素休克的患者，则不宜再选用本品。如应用本品时，一旦发生变态反应，需即停药。如发生过敏性休克，需即就地抢救，给予肾上腺素、保持呼吸道通畅、吸氧、糖皮质激素及抗过敏药等紧急措施。(2) 如在应用过程中发生抗生素相关性肠炎，必须立即停药，采取相应措施。(3) 有胃肠道疾病病史者，特别是结肠炎患者慎用。易发生支气管哮喘、皮疹、荨麻疹等过敏性体质者慎用。不能很好进食或非经口摄取营养者、高龄者、恶病质等患者慎用，因为有出现维生素 K 缺乏症的情况。(4) 虽然本品未显示出对肾功能的影响，应用本品时仍应注意肾功能，特别是在那些接受大剂量治疗的重症患者中。(5) 过长时间应用本品可致不敏感微生物的过度繁殖，需要严密观察，一旦发生二重感染，需采取相应措施。(6) 一次大剂量静脉注射时可引起血管痛、血栓性静脉炎，应尽量减慢注射速度以防其发生。(7) 本品溶解后在室温下放置不宜超过 7 小时，冷处放置不宜超过 48 小时。(8) 妊娠期妇女仅在有明确指征时应用。(9) 本品有少量可分泌至乳汁中，哺乳期妇女应用本品时应暂停哺乳。(10) 6 个月以下小儿使用本品的安全性和有效性尚未确定。(11) 老年患者常伴有肾功能减退，应适当减少剂量或延长给药间期。

【禁忌证】对本品及其他头孢菌素过敏者禁用。

【不良反应】(1) 皮疹、瘙痒和药物热等变态反应、腹泻、恶心、呕吐、食欲缺乏等。(2) 碱性磷酸酶、血清氨基转移酶轻度升高、暂时性血胆红素、血尿素氮和肌酐升高等。(3) 贫血（包括溶血性贫血）、白细胞减少、嗜酸性粒细胞增多或血小板减少少见。(4) 偶见头痛、麻木、眩晕、维生素 K 和维生素 B 缺乏症、过敏性休克。(5) 极少数患者可发生黏膜念珠菌病。(6) 注射部位烧灼感、蜂窝织炎、静脉炎（静脉注射者）、疼痛、硬化和感觉异常等。

【用法用量】静脉滴注：(1) 成人一次 1 ~ 2 g，每 8 ~ 12 小时 1 次；严重感染者的剂量可增至一次 3 ~ 4 g，每 8 小时 1 次。治疗非复杂性尿路感染时，一次 0.5 g，每 12 小时 1 次。(2) 6 个月

及6个月以上的婴儿和儿童按体重一次50 mg/kg，每6～8小时1次。(3) 肾功能损害的患者需根据其损害程度调整剂量。在给予0.5～1 g的首次负荷剂量后，肾功能轻度损害的患者（肌酐清除率每分钟50～79 ml）剂量为一次0.5 g，每8小时1次，严重感染时一次0.75～1.5 g，每8小时1次；肾功能中度损害的患者（肌酐清除率每分钟5～49 ml）常用剂量为一次0.25～0.5 g，每12小时1次，严重感染时一次0.5～1 g，每12小时1次；肾功能重度损害需透析的患者（肌酐清除率每分钟0～4 ml）常用剂量为一次0.5 g，每48小时1次或一次0.25 g，每24小时1次，严重感染时一次0.5～1 g，每48小时1次或一次0.5 g，每24小时1次。血液透析患者透析后可不追加剂量，但需按上述给药剂量和时间，在透析结束时给药。本品可用灭菌注射用水、氯化钠注射液、5%葡萄糖注射液溶解后缓慢静脉注射，亦可加在10%葡萄糖注射液、电解质注射液或氨基酸注射液中静脉滴注30分钟至2小时。

【制剂与规格】注射用头孢唑肟钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

头孢丙烯 [保（乙）]

Cefprozil

【适应证】用于敏感菌所致的轻、中度感染。(1) 上呼吸道感染：①化脓性链球菌性咽炎／扁桃体炎。②肺炎链球菌、嗜血流感杆菌（包括产β-内酰胺酶菌株）和卡他莫拉菌（包括产β-内酰胺酶菌株）性中耳炎。③肺炎链球菌、嗜血流感杆菌（包括产β-内酰胺酶菌株）和卡他莫拉菌（包括产β-内酰胺酶菌株）性急性鼻窦炎。(2) 下呼吸道感染：由肺炎链球菌、嗜血流感杆菌（包括产β-内酰胺酶菌株）和卡他莫拉菌（包括产β-内酰胺酶菌株）引起的急性支气管炎继发细菌感染和慢性支气管炎急性发作。(3) 皮肤和皮肤软组织金黄色葡萄球菌（包括产青霉素酶菌株）和化脓性链球菌引起的非复杂性皮肤和皮肤软组织感染，但脓肿通常需行外科引流排脓。适当时应进行细菌培养和药敏试验以确定病原菌对头孢丙烯的敏感性。

【注意事项】(1) 使用治疗前，应仔细询问患者是否有本品和其他头孢菌素类药物、青霉素类及其他药物的过敏史。有青霉素过敏史者应慎用。对有青霉素类药物所致过敏性休克史或其他严重过敏反应者不宜使用。(2) 如发生过敏反应，应停止用药。严重过敏反应需使用肾上腺素并采取其他紧急措施，包括给氧、静脉输液，静注抗组胺药、皮质激素、升压药及人工呼吸。(3) 长期使用可引起非敏感性微生物的过度生长，改变肠道正常菌群，诱发二重感染，尤其是抗生素相关性肠炎。因此应仔细观察用药患者服药后的反应，特别注意对继发腹泻患者的诊断。如在治疗期间发生二重感染，应采取适当的措施。对抗生素相关性肠炎患者，轻度病例仅需停用药物，而中至重度病例，根据临床症状采取调节水和电解质平衡，补充蛋白，和用对耐药菌有效的抗菌药物治疗。(4) 确诊或疑有肾功能损伤的患者在治疗前和治疗时，应严密观察临床症状并进行适当的实验室检查。在这些患者中，常规剂量时血药浓度较高和（或）排泄减慢，故应减少一日用量。(5) 同时服用强利尿药治疗的患者使用头孢菌素应谨慎，因为这些药物可能会对肾功能产生有害影响。(6) 患有胃肠道疾病，尤其是肠炎患者应慎用。(7) 哺乳期妇女一次口服头孢丙烯1 g，可在乳汁中测得少量药物。由于尚不明确对婴儿的影响，故哺乳期妇女服用时应谨慎。(8) 儿童慎用。(9) 在老年人（≥65岁），本品的平均药-时曲线下面积（AUC）相对于年轻成人增高35%～60%。老年患者宜在医师指导下根据肾功能情况调整用药剂量或用药间期。(10) 对实验室检查指标的干扰：抗球蛋白（Coombs）试验可出现阳性；尿糖还原试验可呈假阳性，但尿糖酶学试验不产生假阳性；高铁氰化物血糖试验可呈假阴性，但葡萄糖酶试验法和抗坏血酸氧化酶试验法不受影响；血清ALT及AST、碱性磷酸酶和血尿素氮可升高。

【禁忌证】对头孢丙烯及其他头孢菌素类过敏患者禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道反应：包括软便、腹泻、胃部不适、食欲减退、恶心、

呕吐、嗳气等。(2) 过敏反应，常见为皮疹，荨麻疹、嗜酸性粒细胞增多、药物热等。儿童发生过敏反应较成人多见，多在开始治疗后几天内出现，停药后几天内消失。(3) 肝胆系统：少见 AST 和 ALT 升高；偶见碱性磷酸酶和胆红素升高；胆汁淤积性黄疸罕见。(4) 中枢神经系统：眩晕，多动，头痛，精神紧张，失眠，偶见神志混乱和嗜睡。所有这些反应均呈可逆性。(5) 血液系统：白细胞减少，嗜酸性粒细胞增多较少见。(6) 肾脏：血清尿素氮增高，血清肌酐增高。蛋白尿、管型尿等。(7) 其他：血红蛋白降低、抗生素相关性肠炎、尿布皮炎样皮疹、生殖器瘙痒和阴道炎。

【用法与用量】口服：(1) 成人（13 岁或以上）：上呼吸道感染，一次 0.5 g，一日 1 次；下呼吸道感染，一次 0.5 g，一日 2 次；皮肤或皮肤软组织感染，一日 0.5 g，分 1 次或 2 次，严重病例一次 0.5 g，一日 2 次。疗程一般 7 ~ 14 日，但 β 溶血性链球菌所致急性扁桃体炎、咽炎的疗程至少 10 日。(2) 儿童：小儿（2 ~ 12 岁）上呼吸道感染：一次 7.5 mg/kg，一日 2 次；皮肤或皮肤软组织感染：一次 20 mg/kg，一日 1 次。小儿（6 个月至 12 岁）中耳炎：一次 15 mg/kg，一日 2 次；急性鼻窦炎：一次 7.5 mg/kg，一日 2 次，严重病例，一次 15 mg/kg，一日 2 次。疗程一般 7 ~ 14 日，但 β 溶血性链球菌所致急性扁桃体炎、咽炎的疗程至少 10 日。(3) 肾功能不全患者服用本品应调整剂量：肌酐清除率每分钟 30 ~ 120 ml 时，给予常用剂量；肌酐清除率每分钟 0 ~ 29 ml 时，给予 50% 的常用剂量。血液透析可清除体内部分头孢丙烯，因此应在血液透析完毕后服用。肝功能受损患者无需调整剂量。(4) 配制方法：干混悬剂先摇松颗粒，分 2 次加水配制，摇匀后服用。

【制剂与规格】头孢丙烯片：① 0.25 g；② 0.5 g。

头孢丙烯分散片：0.25 g。

头孢丙烯咀嚼片：0.25 g。

头孢丙烯胶囊：① 0.25 g；② 0.125 g。

头孢丙烯颗粒剂：0.125 g。

头孢丙烯干混悬剂：① 125 g；② 0.75 g；③ 1.5 g；④ 3.0 g。

头孢噻肟 [保（甲）]

Cefotaxime

【适应证】(1) 敏感细菌所致的肺炎及其他下呼吸道感染、尿路感染、脑膜炎、败血症、腹腔感染、盆腔感染、皮肤软组织感染、生殖道感染、骨和关节感染等。(2) 头孢噻肟可以作为小儿脑膜炎的选用药物。

【注意事项】(1) 用药前须确定是否需进行过敏试验。(2) 交叉过敏反应：对一种头孢菌素或头霉素过敏者对其他头孢菌素类或头霉素也可能过敏。对青霉素或青霉胺过敏者也可能对本品过敏。(3) 对诊断的干扰：应用本品的患者抗球蛋白（Coombs）试验可出现阳性；孕妇产前应用本品，此反应可出现于新生儿。用硫酸铜法测定尿糖可呈假阳性。血清碱性磷酸酶、血尿素氮、ALT 及 AST 或血清乳酸脱氢酶值可增高。(4) 头孢噻肟钠 1.05 g 约相当于 1 g 头孢噻肟，每 1 g 头孢噻肟钠含钠量约为 2.2 mmol（51 mg）。1 g 头孢噻肟溶于 14 ml 灭菌注射用水形成等渗溶液。(5) 肾功能减退者应在减少剂量情况下慎用；有胃肠道疾病或肾功能减退者慎用。(6) 本品与氨基糖苷类抗生素不可同瓶滴注。(7) 本品可经乳汁排出，哺乳期妇女应用本品时虽无发生问题的报告，但应用本品时宜暂停哺乳。本品可透过血胎盘屏障进入胎儿血循环，孕妇应限用于有确切适应证的患者。(8) 老年患者用药根据肾功能适当减量。(9) 婴幼儿不宜做肌内注射。

【禁忌证】对头孢菌素过敏者及有青霉素过敏性休克或即刻反应史者禁用本品。

【不良反应】不良反应发生率低，3%~5%。(1) 有皮疹和药物热、静脉炎、腹泻、恶心、呕吐、食欲缺乏等。(2) 碱性磷酸酶或 AST 及 ALT 轻度升高、暂时性血尿素氮和肌酐升高等。(3) 白细胞减少、酸性粒细胞增多或血小板减少少见。(4) 偶见头痛、麻木、呼吸困难和面部潮红。(5) 极少数患者可发生黏膜念珠菌病。

【用法与用量】(1) 溶液配制：①肌内注射：本品0.5g、1.0g或2.0g分别加入2ml、3ml或5ml灭菌注射用水。②静脉注射：加至少10～20ml灭菌注射用水于上述不同量的本品内，于5～10分钟内徐缓静脉注入。③静脉滴注：将静脉注射液再用适当溶剂稀释至100～500ml。肌内注射剂量超过2g时，应分不同部位注射。(2) 剂量：①成人：单次肌内注射0.5～1.0g，中至重度感染一次肌内1～2.0g，每8～12小时一次。静脉注射或静脉滴注一日2～6g，分2～3次；严重感染者每6～8小时2～3g，一日最高剂量不超过12g。治疗无并发症的肺炎链球菌肺炎或急性尿路感染，每12小时1g。②儿童：新生儿日龄≤7日者每12小时50mg/kg，出生＞7日者，每8小时50mg/kg。治疗脑膜炎患者剂量可增至每6小时75mg/kg，均以静脉给药。③严重肾功能减退患者应用本品时须适当减量。血清肌酐值超过424μmol/L（4.8mg）或肌酐清除率低于每分钟20ml时，本品的维持量应减半；血清肌酐超过751μmol/L（8.5mg）时，维持量为正常量的1/4。需血液透析者一日0.5～2g。但在透析后应加用1次剂量。

【制剂与规格】注射用头孢噻肟钠：①0.5g；②1.0g；③2.0g。

头孢曲松[基(基)，保(甲)]

Ceftriaxone

【适应证】用于敏感致病菌引起的。(1) 脓毒血症，脑膜炎，播散性莱姆病（早、晚期），腹部感染（腹膜炎、胆道及胃肠道感染）。(2) 骨、关节、软组织、皮肤及伤口感染。(3) 免疫机制低下患者之感染。(4) 肾脏及泌尿道感染。(5) 呼吸道感染，尤其是肺炎、耳鼻喉感染。(6) 生殖系统感染，包括淋病。(7) 术前预防感染。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应：对一种头孢菌素或头霉素过敏者对其他头孢菌素或头霉素也可能过敏。对青霉素类、青霉素衍生物或青霉胺过敏者也可能对头孢菌素或头霉素过敏。对青霉素过敏患者应用头孢菌素时发生过敏反应者达5%～10%；如做免疫反应测定时，则对青霉素过敏患者对头孢菌素过敏者达20%。(2) 对青霉素过敏患者应用本品时应根据患者情况充分权衡利弊后决定。有青霉素过敏性休克或即刻反应者，不宜再选用头孢菌素类。(3) 有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎（头孢菌素类很少产生抗生素相关性肠炎）者应慎用。(4) 由于头孢菌素类毒性低，所以有慢性肝病患者应用时不需调整剂量。患者有严重肝肾损害或肝硬化者应调整剂量。(5) 肾功能不全患者肌酐清除每分钟＞5ml，一日应用剂量＜2g时，不需作剂量调整。血液透析清除的量不多，透析后无需增补剂量。(6) 对诊断的干扰：应用头孢曲松的患者以硫酸铜法测尿糖时可获得假阳性反应，以葡萄糖酶法则不受影响；血尿素氮和血清肌酐可有暂时性升高；血清胆红素、碱性磷酸酶、ALT及AST皆可升高。(7) 头孢曲松的保存温度为不超过20℃。(8) 不能加入含钙的溶液中使用。(9) 与氨苯蝶啶、万古霉素、氟康唑以及氨基糖苷类抗生素具有不相容性。(10) 头孢曲松溶液，可在室温下保持其理化稳定性6小时；在2～8℃条件下保持24小时。(11) 孕妇及哺乳期妇女用药：孕妇和哺乳期妇女应用头孢菌素类虽尚未见发生问题的报告，其应用仍须权衡利弊。(12) 儿童用药：新生儿（出生体重小于2kg者）的用药安全尚未确定。有黄疸的新生儿或有黄疸严重倾向的新生儿应慎用或避免使用本品。(13) 老年患者用药：除非老年患者虚弱、营养不良或有重度肾功能损害时，老年人应用头孢曲松一般不需调整剂量。

【禁忌证】(1) 禁用于对本品及其他头孢菌素抗生素过敏的患者。有青霉素过敏性休克史的患者避免应用本品。(2) 头孢曲松不得用于高胆红素血症的新生儿和早产儿的治疗。体外研究显示头孢曲松可从血清蛋白结合部位取代胆红素，从而引起这些患者的胆红素脑病。(3) 在新生儿中，不得与补钙治疗同时进行，否则可能导致头孢曲松的钙盐沉降的危险。

【不良反应】(1) 全身性不良反应：①胃肠道不适（约占病例数的2%）：稀便或腹泻、恶心、呕吐、胃炎和舌炎。②血

液学改变（约 2%）嗜酸细胞增多，白细胞减少，粒细胞减少，溶血性贫血，血小板减少等。曾经报道过粒细胞缺乏（< $500/mm^3$）的独立病例，其中多数都发生在治疗 10 日后，且总剂量为 20 g 以上。③皮肤反应（约 1%）：皮疹、过敏性皮炎、瘙痒、荨麻疹、水肿、多形性红斑等。曾经报道过严重皮肤反应（多形性红斑，Stevens-Johnson 综合征或 Lyell 综合征）的独立病例。(2) 其他罕见不良反应：①头痛和眩晕，症状性头孢曲松钙盐之胆囊沉积，肝脏氨基转移酶增高，少尿，血肌酐增加，生殖道真菌病，发热，寒战以及过敏性或过敏样反应。②头孢曲松与钙结合，可致新生儿和早产儿肾、肺内沉积，可致严重不良性反应，不得与含钙注射剂配伍。③抗生素相关性肠炎及凝血障碍是极其罕见的不良反应。④极为罕见的肾脏沉积病例，多见于 3 岁以上儿童，他们曾接受一日大剂量（如一日 ≥ 80 mg/kg）治疗，或总剂量超过 10 g，并有其他威胁因素（如限制液体、卧床等）。这一事件可以是有症状的或无症状的，会导致肾功能不全，但停药后可以逆转。(3) 局部不良反应：①在极少的情况下，静脉用药后发生静脉炎，可通过减慢静脉注射速度（2 ~ 4 分钟）以减少此现象的发生。②肌内注射时，如不加用利多卡因会导致疼痛。

【用法与用量】(1) 用法：肌内注射或静脉注射、滴注。①新配制的溶液能在室温下保持其物理及化学稳定性达 6 小时或在 5℃环境下保持 24 小时。但按一般原则，配制后的溶液应立刻使用。②肌内注射：0.25 g 或 0.5 g 溶于 1% 盐酸利多卡因注射液 2 ml 中，(1 g 则溶于 3.5 ml）中用于肌内注射，以注射于相对大些的肌肉为好，也不主张在一处肌内注射 1 g 以上剂量。加入利多卡因的本品溶液禁用于静脉注射。③静脉注射：0.25 g 或 0.5 g 溶于 5 ml 注射用水中，1 g 溶于 10 ml 中用于静脉注射，注射时间不能少于 2 ~ 4 分钟。④静脉滴注：2 g 溶于 40 ml 以下其中一种无钙静脉注射液中，如氯化钠溶液、0.45% 氯化钠 + 2.5% 葡萄糖注射液、5% 葡萄糖、10% 葡萄糖、5% 葡萄糖中加 6% 葡聚糖、6% ~ 10% 羟乙基淀粉静脉注射液、注射用水等。由于可能会产生药物间的不相容性，故不能将头孢曲松混合或加入含有其他抗菌药物的溶液中。亦不能将其稀释于以上列出的溶液之外的其他液体中。静脉滴注时间至少要 30 分钟。(2) 用量：①成人及 12 岁以上儿童：剂量 1 ~ 2 g，一日 1 次（每 24 小时）。危重病例或由中度敏感菌引起之感染，剂量可增至 4 g，一日 1 次。② 12 岁以下儿童建议以下剂量一日使用 1 次。新生儿（14 日以下）一日剂量为按体重 20 ~ 50 mg/kg，不超过 50 mg/kg，无需区分早产儿及足月婴儿。婴儿及儿童（15 日至 12 岁）一日剂量按体重 20 ~ 80 mg/kg；体重 50 kg 或以上的儿童，应使用通常成人剂量。③静脉用量按体重 50 mg/kg 以上时，输注时间至少要 30 分钟以上。④疗程：疗程取决于病程。与一般抗生素治疗方案一样。在发热消退或得到细菌被清除的证据以后，应继续使用至少 48 ~ 72 小时。⑤肾功能衰竭患者（肌酐清除率每分钟 < 10 ml）一日用量不能超过 2 g。严重的肝、肾功能障碍者，应定期监测头孢曲松的血药浓度。⑥正在接受透析治疗的患者，无须在透析后另加剂量，但由于这类患者的药物清除率可能会降低，故应进行血药浓度监测，以决定是否需要调整剂量。

【制剂与规格】注射用头孢曲松钠：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 0.75 g；④ 1.0 g；⑤ 1.5 g；⑥ 2.0 g；⑦ 3.0 g；⑧ 4.0 g。

头孢哌酮 Cefoperazone

【适应证】用于敏感菌所致的各种感染如肺炎及其他下呼吸道感染、尿路感染、胆道感染、皮肤软组织感染、败血症、腹膜炎、盆腔感染等，后两者宜与抗厌氧菌药联合应用。

【注意事项】(1) 治疗婴儿感染也获较好疗效，但对早产儿和新生儿的研究尚缺乏资料。(2) 对诊断的干扰：用硫酸铜法进行尿糖测定时可出现假阳性反应，直接抗球蛋白（Coombs）试验呈阳性反应。产妇临产前应用头孢哌酮，新生儿此试验亦可为阳性。偶有碱性磷酸酶、ALT 及 AST、血清肌酐和血尿素氮增高。(3) 肝病和（或）胆道梗阻患者，半衰期延长

（病情严重者延长 2 ~ 4 倍），尿中头孢哌酮排泄量增多；但肝病、胆道梗阻严重或同时有肾功能减退者，胆汁中仍可获得有效治疗浓度；给药剂量须予适当调整，且应进行血药浓度监测。如不能进行血药浓度监测时，一日给药剂量不应超过 2 g。(4) 部分患者可引起维生素 K 缺乏和低凝血酶原血症，用药期间应进行出血时间、凝血酶原时间监测。同时应用维生素 K_1 可防止出血现象的发生。(5) 长期应用头孢哌酮可引起二重感染。(6) 交叉过敏：对任何一种头孢菌素过敏者对本品也可能过敏。(7) 乳汁中头孢哌酮的含量少，哺乳期妇女应用本品时宜暂停哺乳。(8) 新生儿和早产儿应用本品时，应权衡利弊，谨慎考虑。

【禁忌证】对头孢菌素类过敏及有青霉素过敏休克和即刻反应史者禁用本品。

【不良反应】(1) 皮疹较为多见。(2) 少数患者尚可发生腹泻、腹痛、嗜酸性粒细胞增多，轻度中性粒细胞减少。(3) 暂时性 AST 及 ALT、碱性磷酸酶、尿素氮或血肌酐升高。(4) 血小板减少、凝血酶原时间延长等可见于个别病例。偶有出血者，可用维生素 K 预防或控制。(5) 菌群失调可在少数患者出现。(6) 应用本品期间饮酒或接受含乙醇药物或饮料者可出现双硫仑样反应。

【用法与用量】(1) 用法：可供肌内注射、静脉注射或静脉滴注。①制备肌内注射液，每 1 g 药物加灭菌注射用水 2.8 ml 及 1.2% 利多卡因注射液 1 ml，其浓度为 250 mg/ml。②静脉徐缓注射者，每 1 g 药物加葡萄糖氯化钠注射液 40 ml 溶解。③供静脉滴注者，取 1 ~ 2 g 头孢哌酮溶解于 100 ~ 200 ml 葡萄糖氯化钠注射液或其他稀释液中，最后药物浓度为 5 ~ 25 mg/ml。每 1 g 头孢哌酮的钠含量为 1.5 mmol (34 mg)。(2) 用量：①成人：一般感染，一次 1 ~ 2 g，每 12 小时 1 次；严重感染，一次 2 ~ 3 g，每 8 小时 1 次。接受血液透析者，透析后应补给 1 次剂量。成人一日剂量不超过 9 g，但在免疫缺陷患者有严重感染时，剂量可加大至一日 12 g。②儿童：一日 50 ~ 200 mg/kg，分 2 ~ 3 次静脉滴注。

【制剂与规格】注射用头孢哌酮钠：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 1.5 g；④ 2.0 g。

头孢哌酮舒巴坦 [保(乙)]

Cefoperazone and Sulbactam

【适应证】用于治疗敏感菌所引起的下列感染：①上、下呼吸道感染。②上、下泌尿道感染。③腹膜炎、胆囊炎、胆管炎和其他腹腔内感染。④败血症。⑤脑膜炎。⑥皮肤和软组织感染。⑦骨骼及关节感染、盆腔炎。⑧子宫内膜炎、淋病及其他生殖系统感染。

【注意事项】(1) 过敏反应：接受 β-内酰胺类或头孢菌素类抗生素治疗的患者可发生严重的及偶可发生的致死性过敏反应。这些过敏反应更易发生在对多种过敏原有过敏史的患者中。一旦发生过敏反应，应立即停药并给予适当的治疗。发生严重过敏反应的患者须立即给予肾上腺素紧急处理，必要时应吸氧、静脉给予激素，并采用包括气管内插管在内的畅通气道等治疗措施。(2) 肝功能障碍患者的用药：头孢哌酮主要经胆汁排泄。当患者有肝脏疾病和（或）胆道梗阻时，头孢哌酮的血浆半衰期通常延长并且由尿中排出的药量会增加。即使患者有严重肝功能障碍时，头孢哌酮在胆汁中仍能达到治疗浓度且其半衰期延长 2 ~ 4 倍。遇到严重胆道梗阻、严重肝脏疾病或同时合并肾功能障碍时，可能需要调整用药剂量。同时合并有肝功能障碍和肾功能损害的患者，应监测头孢哌酮的血清浓度，根据需要调整用药剂量。对这些患者如未密切监测本品的血清浓度，头孢哌酮的一日剂量不应超过 2 g。(3) 一般注意事项：①少数患者使用头孢哌酮治疗后出现了维生素 K 缺乏，营养不良、吸收不良（如肺囊性纤维化患者）和长期静脉输注高营养制剂在内的患者存在上述危险。应监测上述这些患者以及接受抗凝血药治疗患者的凝血酶原时间，需要时应另外补充维生素 K。②长期使用本品可引起不敏感细菌过度生长。在治疗过程中应仔细观察患者的病情变化。③建议在疗程较长时应定期检查患者是否存在各系统器官的功能障碍，其中包括肾脏、肝脏和血液系统。对新生儿，尤其是

早产儿和其他婴儿特别重要。（4）配伍禁忌：①与乳酸钠林格注射液混合后有配伍禁忌，因此应避免在最初溶解时使用该溶液。在两步稀释法中，先用注射用水进行最初的溶解，再用乳酸钠林格注射液做进一步稀释，从而得到能够相互配伍的混合药液。②与氨基糖苷类抗生素之间有物理性配伍禁忌，因此两种药液不能直接混合。如确需本品与氨基糖苷类抗生素合用时，可采用序贯间歇静脉输注给药，但必须使用不同的静脉输液管，或在输注间歇期用一种适宜的稀释液充分冲洗先前使用过的静脉输液管。另外，建议在全天用药过程中本品与氨基糖苷类抗生素两者给药的间隔时间尽可能长一点。③与2%盐酸利多卡因注射液混合后有配伍禁忌，因此应避免在最初溶解时使用此溶液。在两步稀释法中，先用注射用水进行最初的溶解，再用2%盐酸利多卡因注射液做进一步稀释，从而得到能够相互配伍的混合药液。（5）动物实验中没有发现本品对生殖能力和胎仔的损害，但在人类中尚缺乏足够的对照研究资料。因此孕妇应慎用，只有在明确指征时使用本品。（6）头孢哌酮和舒巴坦可在乳汁中少量分泌，对哺乳期妇女慎用。（7）对早产儿和新生儿尚未进行过广泛的研究，故在用于新生儿和早产儿前必须权衡利弊后谨慎应用。（8）老年人呈生理性的肝、肾功能减退，因此应慎用本品并需调整剂量。

【禁忌证】已知对青霉素类，舒巴坦、头孢哌酮及其他头孢菌素类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】（1）胃肠道反应：腹泻/稀便最为常见，其次为恶心和呕吐。（2）皮肤反应：表现为斑丘疹和荨麻疹。（3）血液系统：长期使用本品可发生可逆性中性粒细胞减少症；可出现Coombs阳性反应；可降低血红蛋白和血细胞比容；一过性嗜酸性粒细胞增多和血小板减少症；低凝血酶原血症。（4）其他：头痛、发热、注射部位疼痛和寒战。（5）实验室检查异常：ALT及AST、碱性磷酸酶、胆红素一过性升高。（6）局部反应：偶有注射后注射部位出现一过性疼痛。当通过静脉插管注射头孢哌酮舒巴坦时，可在注射部位发生静脉炎。（7）一般不良反应：过敏反应（包括休克）、低血压、抗生素相关性肠炎、淋巴细胞减少症、皮肤瘙痒、Stevens-Johnson综合征、血尿、血管炎等。

【用法与用量】（1）用法：静脉给药：①间歇静脉滴注时，每瓶头孢哌酮舒巴坦用适量的5%葡萄糖溶液或0.9%注射用氯化钠溶液或灭菌注射用水溶解，然后再用上述相同溶液稀释至5～100 ml，静脉滴注时间应至少为30～60分钟。尽管乳酸钠林格注射液可作为头孢哌酮舒巴坦静脉注射液的溶媒，但不能用于本品最初的溶解过程。②静脉注射时，每瓶头孢哌酮舒巴坦应按上述方法溶解，静脉注射时间至少应超过3分钟。（2）用量：①成人：一日2.0～4.0 g，分2次给予，每12小时给药1次。在严重感染或难治性感染时，一日剂量可增加到8 g。病情需要时，可另外单独增加头孢哌酮的用量，所用剂量应等分，每12小时给药1次。舒巴坦一日推荐最大剂量为4 g。②儿童：常用量一日40～80 mg/kg，分2～4次滴注。严重或难治性感染可增至一日160 mg/kg。分2～4次滴注。新生儿出生第一周内，应每隔12小时给药1次。舒巴坦一日最高剂量不超过80 mg/kg。③肝功能障碍患者用药：参见【注意事项】部分。④肾功能障碍患者用药：肾功能明显降低的患者，舒巴坦清除减少。肌酐清除率为每分钟15～30 ml的患者，一日舒巴坦的最高剂量为1g，分等量，每12小时注射1次。肌酐清除率每分钟＜15 ml的患者一日舒巴坦的最高剂量为0.5 g，分等量，每12小时注射一次。对严重感染者，必要时可单独增加头孢哌酮的用量。⑤在血液透析患者中，舒巴坦的药动学特性有明显改变。头孢哌酮在血液透析患者中的血清半衰期轻微缩短。因此在血液透析后，应给予一剂头孢哌酮舒巴坦。

【制剂与规格】注射用头孢哌酮钠舒巴坦钠（1∶1）：①1.0 g（头孢哌酮钠0.5 g∶舒巴坦钠0.5 g）；②2.0 g（头孢哌酮钠1.0 g∶舒巴坦钠1.0 g）。

注射用头孢哌酮钠舒巴坦钠（2∶1）：①1.5 g（头孢哌酮钠1.0 g∶舒巴坦钠0.5 g）；②2.25 g（头孢哌酮钠1.5 g∶

舒巴坦钠0.75g)；③3g（头孢哌酮钠2.0g：舒巴坦钠1.0g)；④4.5g（头孢哌酮钠3.0g：舒巴坦钠1.5g)。

头孢他啶[保(乙)]

Ceftazidime

【适应证】(1) 敏感细菌所引起的单一感染及由两种或两种以上的敏感菌引起的混合感染。全身性的严重感染；呼吸道感染；耳鼻喉感染；尿路感染；皮肤及软组织感染；胃肠、胆及腹部感染；骨骼及关节感染；与血液透析和腹膜透析及持续腹膜透析（CAPD）有关的感染。(2) 脑膜炎。仅在得到敏感试验结果后，才能应用单一的头孢他啶治疗。(3) 耐其他抗生素（包括氨基糖苷类和多数头孢菌素）的感染。如果合适，可联同氨基糖苷类或其他β-内酰胺类抗生素使用，例如在严重中性粒细胞减少时，或在怀疑是脆弱拟杆菌感染时，与另一种抗厌氧菌抗生素合用。(4) 经尿道前列腺切除手术的预防治疗。

【注意事项】(1) 过敏反应：在应用头孢他啶治疗前应仔细询问对头孢菌素类、青霉素类或其他药物的过敏反应史。对青霉素或β-内酰胺类抗生素曾有过敏反应的患者应给予特别关注。只在备有特别谨慎措施时才可在对青霉素有Ⅰ型或即发过敏反应的患者应用头孢他啶，如果对头孢他啶发生过敏反应，应停止用药，严重的过敏反应可能需要采用肾上腺素，氢化可的松，抗组胺药或其他紧急措施。(2) 肾功能：①正在接受肾毒性药物（如氨基糖苷类抗生素，或强效的利尿药如呋塞米）的患者，同时使用高剂量头孢菌素类抗生素时应谨慎，因这些药合用会影响肾功能。头孢他啶的临床经验证明推荐的剂量一般不会发生这些问题。②肾功能不全的患者使用时，剂量需根据肾功能的降低程度而相应减少。当剂量没有得到适当降低时，偶有神经性后遗症报道。(3) 非敏感菌的过度生长：长期使用头孢他啶可能会引起非敏感菌过度生长（如念珠菌属，肠球菌)，可能需要终止治疗或采取适当的措施。必须反复判断患者的病情。(4) 敏感菌耐药：在使用头孢他啶治疗的过程中，一些原本对本品敏感的菌属如大肠埃希菌属和沙雷菌属可能会产生耐药。因此使用本品对上述菌属感染治疗的过程中，应定期进行敏感性测试。(5) 配伍禁忌：①头孢他啶在碳酸氢钠注射液内的稳定性较次于其他的静脉注射液。②头孢他啶与氨基糖苷类抗生素不应混合在同一给药系统或注射器内。③万古霉素加入已制成的头孢他啶注射液后，会出现沉淀。因此在先后给予两种药物的过程中，必须谨慎冲洗给药系统和静脉系统。(6) 妊娠初期和妊娠前3个月妇女应慎用。对于孕妇，应权衡预期的益处大于可能的危险时，才可使用。(7) 低浓度的头孢他啶可经乳腺排入乳汁中，哺乳期妇女应用头孢他啶时应谨慎。

【禁忌证】禁用于对本品及其他头孢菌素过敏的患者。

【不良反应】(1) 感染和侵袭性疾病：不常见念珠菌病（包括阴道炎和口腔鹅口疮)。(2) 血液和淋巴系统紊乱：常见嗜酸性粒细胞增多和血小板增多；不常见白细胞减少、中性粒细胞减少和血小板减少；非常罕见的有淋巴细胞增多，溶血性贫血和粒细胞缺乏。(3) 免疫系统紊乱：非常罕见过敏反应（包括支气管痉挛或低血压)。(4) 神经系统紊乱：不常见头痛、眩晕；非常罕见皮肤感觉异常。当有肾脏损害的患者使用头孢他啶没有适当减量时，曾有神经后遗症的报道，包括震颤、肌阵挛、惊厥、脑病和昏迷。(5) 血管系统紊乱：常见因静脉给药引起的静脉炎或血栓性静脉炎。(6) 胃肠道紊乱：常见腹泻；偶见恶心、呕吐、腹痛和结肠炎；罕见味觉障碍。与其他头孢菌素一样，结肠炎可能与艰难梭状芽胞杆菌有关，并可能会表现为抗生素相关性肠炎。(7) 肝胆紊乱：常见一项或多项肝酶短暂升高，包括ALT、AST、乳酸脱氢酶（LDH)、谷氨酰转移酶（GGT）和碱性磷酸酶；非常罕见黄疸。(8) 皮肤及皮下组织紊乱：常见斑丘疹或荨麻疹；不常见瘙痒症；非常罕见血管性水肿、多形性红斑、Stevens-Johnson综合征和中毒性表皮坏死松解症的报告。(9) 全身性紊乱和注射部位反应：常见在肌内注射后注射部位疼痛和（或）发炎；不常见发热。(10) 实验室检查：

常见 Coombs 试验阳性；不常见：与其他的头孢菌素类一样，观察到血尿素，血尿素氮和（或）血清肌酐的短暂升高。

【用法与用量】(1) 用法：①静脉给药或深部肌内注射给药。②最好使用新配制的注射液。如果不能实现，存放在 2～8℃冰箱中保存 24 小时可保持药效。③肌内注射用时可用 0.5% 或 1% 盐酸利多卡因注射液配制。(2) 用量：剂量依感染的严重程度、微生物敏感性及患者年龄、体重和肾功能而定。①成人：一日 1～6 g，分每 8 小时或每 12 小时做静脉注射或肌内注射给药。对于大多数感染，每 8 小时 1 g 或每 12 小时 2 g。尿路感染及许多较轻的感染，一般每 12 小时 500 mg 或 1 g。非常严重的感染，特别是免疫抑制的患者，包括患有嗜中性粒细胞减少症者，每 8 或 12 小时 2 g 或每 12 小时 3 g。当用作前列腺手术预防治疗时，第 1 次 1 g（从 1 g 瓶中）用于诱导麻醉期间，第 2 次用于撤除导管时。肾功能正常而患有假单孢菌类肺部感染的纤维囊性成年患者，按体重一日 100～150 mg/kg，分 3 次给药。肾功能正常的成年人，一日剂量可达 9g。②儿童：2 个月以上的儿童，一般的剂量范围是按体重一日 30～100 mg/kg，分 2 或 3 次给药。对于免疫受抑制或患有纤维化囊肿的感染或患有脑膜炎的儿童，按体重一日 150 mg/kg（最高剂量一日 6 g），分 3 次给药。新生儿至 2 个月龄的婴儿，按体重一日 25～60 mg/kg，分 2 次给药。新生婴儿的头孢他啶血清半衰期是成人的 3～4 倍。③老年患者的头孢他啶的清除率有所减低，尤其在年龄大于 80 岁的患者，一日不超过 3 g。④肾功能损害者：首次给予 1 g，然后，根据肾小球滤过率来决定合适的维持剂量。对于严重感染的患者，特别是中性粒细胞减少症的患者，可依据肾功能不全推荐的剂量的一次剂量增加 50% 或适当增加给药频率。用药过程中一定要监测头孢他啶的血清浓度，谷浓度不应超过 40 mg/L。正在监护室接受连续动静脉或高流量血透的肾衰竭的患者，推荐剂量为一日 1 g，分次给药。对于低流量血透法的患者，因参照肾功能不全推荐的剂量。在血透过程中，头孢他啶的血清半衰期为 3～5 小时。一次血透结束后，应重复给予适当的头孢他啶的维持剂量。肾功能不全者根据肌酐清除率的剂量，见表 9-6。

表 9-6 肾功能不全时头孢他啶的用量和用法

肌酐清除率(ml)	用 量	用 法
每分钟 50～31	一次 1 g	12 小时 1 次
每分钟 30～16	一次 1 g	24 小时 1 次
每分钟 15～6	一次 0.5 g	24 小时 1 次
每分钟＜6	一次 0.5 g	48 小时 1 次

【制剂与规格】注射用头孢他啶：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 1.0 g；④ 2.0 g。

头孢克肟[保(乙)]

Cefixime

【适应证】用于对头孢克肟敏感的链球菌属（肠球菌除外），肺炎球菌、淋球菌、卡他布壮汉球菌、大肠球菌、克雷伯杆菌属、沙雷菌属、变形杆菌属、流感杆菌等引起的感染。①慢性支气管炎急性发作、急性支气管炎并发作细菌感染、支气管扩张合并感染、肺炎。②肾盂肾炎、膀胱炎、淋球菌性尿道炎。③急性胆道系统细菌性感染（胆囊炎、胆管炎）。④猩红热。⑤中耳炎、鼻窦炎。

【注意事项】(1) 由于有可能出现休克，给药前应充分询问病史。(2) 为防止耐药菌株的出现，在使用前原则上应确认敏感性，将剂量控制在控制疾病所需最小剂量。(3) 对于严重肾功能障碍患者，由于药物在血液中可维持浓度，因此应根据肾功能状况适当减量，给药间隔应适当增大。(4) 下列患者慎重给药：①对青霉素类药物有过敏史的患者。②本人或父母、兄弟中，具有易引起支气管哮喘、皮疹、荨麻疹等过敏症状体质的患者。③严重的肾功能障碍患者。④经口给药困难或非经口营养患者，全身恶病质状态患者（因时有出现维生素 K 缺乏症状，应注意观察）。(5) 对临床检验结果的影响：①除试纸反应以外，对 Benedict 试剂、Fehling 试剂、尿糖试药丸进行尿糖检查，有假阳性出现的可能性，应予以注意。②有出现直接 Coombs 试验阳性的可能性。(6) 不要将

牛奶、果汁等与药混合后放置。(7) 关于妊娠用药的安全性尚未确定，故对孕妇或有妊娠可能性的妇女用药时，需权衡利弊。未研究头孢克肟对分娩的影响，只有在明确需要使用时方可使用。头孢克肟是否经人乳排泄尚不清楚，在使用时应考虑暂停授乳。(8) 头孢克肟对小于 6 个月的儿童的安全性和有效性尚未确定。(9) 在老年人中的血药峰浓度和 AUC 可较年轻人分别高 26% 和 20%，老年患者可以使用本品。(10) 肾功能不全患者应调整给药剂量。肌酐清除率每分钟≥ 60 ml 的患者可按普通剂量及疗程使用；肌酐清除率为每分钟 20 ~ 60 ml 或血液透析患者可按标准剂量的 75%（标准给药间隔）给予；肌酐清除率每分钟＜ 20 ml 或常久卧床腹膜透析患者可按标准剂量的一半（标准给药间隔）给予。

【禁忌证】对头孢克肟及其成分或其他头孢菌素类药物过敏者禁用。

【不良反应】主要不良反应有腹泻等消化道反应、皮疹等皮肤症状、临床检查值异常，包括肝功能指标升高、嗜酸性粒细胞增多等。可能发生的严重不良反应有：①休克；②过敏样症状（包括呼吸困难、全身潮红、血管性水肿、荨麻疹等）；③皮肤病变，如 Stevens-Johnson 综合征、中毒性表皮坏死松解症；④血液障碍，如粒细胞缺乏症、溶血性贫血、血小板减少；⑤急性肾功能不全；⑥抗生素相关性肠炎；⑦间质性肺炎。

【用法与用量】口服：①成人和体重 30 kg 以上的儿童。一次 50 ~ 100 mg（效价），一日 2 次。此外，可以根据年龄、体重、症状进行适当增减，对重症患者，可一次口服 200 mg（效价），一日 2 次。② 30 kg 以下儿童。按体重一次 1.5 ~ 3 mg（效价）/kg，一日 2 次。此外，可以根据症状进行适当增减，对于重症患者，可一次口服 6 mg（效价）/kg，一日 2 次。

【制剂与规格】头孢克肟片：① 50 mg；② 0.1 g。

头孢克肟咀嚼片：① 50 mg；② 0.1 g。

头孢克肟分散片：0.1 g。

头孢克肟胶囊：① 50 mg；② 0.1 g。

头孢克肟颗粒：50 mg。

头孢泊肟酯

Cefpodoxime Proxetil

【适应证】用于对本品敏感的葡萄球菌属、链球菌属（包括肺炎链球菌）、淋球菌、卡他莫拉菌、克雷伯杆菌属、大肠埃希菌、变形杆菌属、枸橼酸杆菌属、肠杆菌属、流感嗜血杆菌等引起的轻、中度感染。①呼吸道感染：包括咽喉炎、咽喉脓肿、扁桃体炎、扁桃体周围炎、扁桃体周围脓肿、急性气管支气管炎、慢性支气管炎急性发作、支气管扩张症继发感染、肺炎。②泌尿生殖系统感染：包括肾盂肾炎、膀胱炎、前庭大腺炎、前庭大腺脓肿、淋菌性尿道炎等。③皮肤及软组织感染：包括毛囊炎、疖、疖肿症、痈、丹毒、蜂窝织炎、淋巴管（结）炎、化脓性甲沟炎、皮下脓肿、汗腺炎、感染性粉瘤、肛门周围脓肿等。④中耳炎、鼻旁窦炎。⑤乳腺炎。

【注意事项】(1) 避免与抗酸药、H_2 受体拮抗药、质子泵抑制药同时服用。(2) 严重肾功能损害患者应慎用，如必须使用时，应调节给药剂量和给药间隔。(3) 对青霉素类抗生素有过敏史的患者慎用。(4) 易引起支气管哮喘、荨麻疹、湿疹等过敏症状体质的患者慎用。(5) 全身营养状态不佳者慎用。(6) 孕妇只有在确实需要时才能使用；尚无在分娩中使用的经验，所以，只有在确实需要时才能使用；头孢泊肟酯可在人乳中分泌，由于本品对哺乳的婴儿有潜在的严重反应，所以应权衡对母亲的利弊后，再确定是中断哺乳或停药。(7) 老年患者与其他成年人之间未见不良反应差异，但通常老年患者多见生理功能降低，易出现不良反应及维生素 K 缺乏引起的出血倾向，应慎用。

【禁忌证】对头孢菌素过敏者及有青霉素过敏性休克或即刻反应史者禁用。

【不良反应】(1) 严重不良反应：①偶可引起休克反应。②偶可出现 Stevens-Johnson 综合征和中毒性表皮坏死松解症。③偶可出现假膜性大肠炎等伴有血便的严重肠炎。④偶可引起全血细胞减少症、粒细胞缺乏症、溶血性贫血、急性肾衰竭、间质性肺炎等。(2) 其他不良反应：①过敏反应：皮疹、荨麻疹、瘙痒、发热、淋

巴结肿大、关节痛等。②消化系统：有时出现恶心、呕吐、腹泻、胃痛、腹痛、食欲减退、胃部不适感。③血液系统：有时出现嗜酸性粒细胞增多、血小板减少、偶见粒细胞减少。④肝功能：偶见 AST、ALT、ALP、LDH 等升高。⑤肾功能：有时出现 BUN、Cr 升高。⑥维生素缺乏症：偶可出现维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原血症、出血倾向等）、维生素 B 族缺乏症状（舌炎、口内炎、食欲减退、神经炎等）。⑦其他：偶尔眩晕、头痛、水肿。

【用法与用量】餐后口服：(1) 成人：①上呼吸道感染包括急性中耳炎、鼻窦炎、扁桃体炎和咽喉炎等，一次 100 mg，一日 2 次，疗程 5 ~ 10 日。②下呼吸道感染：慢性支气管炎急性发作，一次 200 mg，一日 2 次，疗程 10 日。③急性社区获得性肺炎，一次 200 mg，一日 2 次，疗程 14 日。④单纯性泌尿道感染，一次 100 mg，一日 2 次，疗程 7 日。⑤急性单纯性淋病，单剂量 200 mg。⑥皮肤和皮肤软组织感染，一次 400 mg，一日 2 次，疗程 14 日。(2) 儿童：①急性中耳炎，一次 10 mg/kg，一日 1 次，或一次 5 mg/kg，一日 2 次（一日最大剂量不超过 400 mg，或一次 200 mg，一日 2 次），疗程 10 日。②扁桃体炎、鼻窦炎，一日 10 mg/kg（最大剂量不超过一日 200 mg，分 2 次服用），疗程 5 ~ 10 日。

【制剂与规格】头孢泊肟酯片剂：① 0.1 g；② 0.2 g。

头孢泊肟酯分散片：0.1 g。

头孢泊肟酯胶囊：① 0.1 g，② 50 mg。

头孢泊肟酯干混悬剂：① 0.1 g；② 50 mg；③ 36 g : 0.6 g；④ 36 g : 1.2 g。

头孢泊肟酯颗粒剂：40 mg。

头孢吡肟 [保(乙)]

Cefepime

【适应证】用于对头孢吡肟敏感的需氧革兰阴性菌中的肠杆菌，包括阴沟肠杆菌、产气肠杆菌、肺炎克雷伯杆菌、沙雷菌，埃希菌、铜绿假单胞杆菌、奇异变形杆菌、普通变形杆菌、聚团肠杆菌属、柠檬酸杆菌、不动杆菌属、嗜血流感杆菌（包括产β-内酰胺酶株）、沙门菌属、蜂房哈尼夫菌、摩氏摩根菌、志贺菌属、淋球菌和革兰阳性球菌，包括肺炎链球菌（包括耐青霉素菌）、溶血性链球菌、化脓性链球菌、无乳链球菌、草绿色链球菌等链球菌属细菌、甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌、甲氧西林敏感表皮葡萄球菌等葡萄球菌，以及厌氧菌中的类杆菌（包括产黑色素类杆菌和其他经口感染的类杆菌）、产气荚膜梭状菌、梭状菌、动弯杆菌属菌，消化链球菌和丙酸杆菌引起的中重度感染。①下呼吸道感染（肺炎和支气管炎）；②单纯性下尿路感染和复杂性尿路感染（包括肾盂肾炎）；③非复杂性皮肤和皮肤软组织感染；④复杂性腹腔内感染（包括腹膜炎和胆道感染）；⑤妇产科感染；⑥败血症；⑦中性粒细胞减少伴发热患者的经验治疗；⑧儿童细菌性脑脊髓膜炎。

【注意事项】(1) 使用本品前，应该确定患者是否有头孢吡肟、其他头孢菌素类药物，青霉素或其他β-内酰胺类抗生素过敏史。对于任何有过敏，特别是药物过敏史的患者应谨慎。(2) 可诱发抗生素相关性肠炎。(3) 有胃肠道疾患，尤其是肠炎患者慎用。(4) 可能会引起凝血酶原活性下降。如肝肾功能不全、营养不良及延长抗菌治疗的患者应监测凝血酶原时间。必要时给予外源性维生素 K。(5) 本品所含精氨酸在所用剂量为最大推荐剂量的 33 倍时会引起葡萄糖代谢紊乱和一过性血钾升高。较低剂量时精氨酸的影响尚不明确。(6) 对肾功能不全的患者，用量应根据肾功能调整。(7) 头孢吡肟与氨基糖苷类抗生素或强效利尿药合用时，应加强临床观察。并监测肾功能，避免引发肾毒性或耳毒性。(8) 尚无用于孕妇和分娩时妇女的临床资料，孕妇谨慎。头孢吡肟在人乳汁中有极少量排出（浓度约 0.5 μg/ml），哺乳期妇女慎用。(9) 老年患者肾功能正常时使用一般推荐剂量；肾功能不全老年患者，使用时应根据肾功能调整。

【禁忌证】禁用于对头孢吡肟或 *L*-精氨酸，头孢菌素类药物，青霉素或其他β-内酰胺类抗生素有过敏反应的患者。

【不良反应】(1) 常见腹泻，皮疹和注射局部反应，如静脉炎，注射部位疼痛和炎症。(2) 其他包括恶心，呕吐，过敏，

瘙痒，发热，感觉异常和头痛。(3) 肾功能不全患者而未相应调整头孢吡肟剂量时，可引起脑病、肌痉挛、癫痫。(4) 治疗儿童脑膜炎患者，偶有惊厥、嗜睡、神经紧张和头痛，主要是脑膜炎引起，与本品无明显关系。(5) 偶见肠炎（抗生素相关性肠炎）、口腔念珠菌感染。(6) 实验室检查异常多为一过性，停药即可恢复，包括血清磷升高或减少，ALT 或 AST 升高，嗜酸性粒细胞增多，部分凝血酶原时间和凝血酶原时间延长。碱性磷酸酶、血尿素氮、肌酐、血钾、总胆红素升高，血钙降低，血细胞比容减少。与其他头孢菌素类抗生素类似，也有白细胞减少、粒细胞减少、血小板减少的报道。(7) 还可引起 Stevens-Johnson 综合征、多形性红斑、毒性表皮坏死、肾功能紊乱、毒性肾病、再生障碍性贫血、溶血性贫血、出血、肝功能紊乱（胆汁淤积）和血细胞减少。

【用法与用量】(1) 用法：静脉滴注或深部肌内注射给药。①静脉给药：静脉滴注时，将 1 ~ 2 g 溶于 50 ~ 100 ml 0.9% 氯化钠注射液，5% 或 10% 葡萄糖注射液，1/6 mol/L 乳酸钠注射液，5% 葡萄糖和 0.9% 氯化钠混合注射液，乳酸林格和 5% 葡萄糖混合注射液中，药物浓度不应超过 40 mg/ml，于 30 分钟滴毕。②肌内注射：将 0.5 g 加 1.5 ml 注射用水，或 1 g 加 3.0 ml 溶解后，经深部肌群（如臀肌群或外侧股四头肌）注射。(2) 用量：①成人：成人和 16 岁以上儿童或其体重 40 kg 以上者，一次 1 ~ 2 g，每 12 小时 1 次，静脉滴注，疗程 7 ~ 10 日。轻中度尿路感染，一次 0.5 ~ 1 g，静脉滴注或深部肌内注射，疗程 7 ~ 10 日。重度尿路感染，一次 2 g，每 12 小时 1 次，静脉滴注，疗程 10 日。严重感染并危及生命时，可以每 8 小时 2 g 静脉滴注。用于中性粒细胞减少伴发热的经验治疗，一次 2 g，每 8 小时 1 次，静脉滴注，疗程 7 ~ 10 日或至中性粒细胞减少缓解。如虽缓解但中性粒细胞仍处于异常低水平，应重新评价是否继续使用。②儿童：2 个月龄至 12 岁儿童，最大剂量不可超过成人剂量（即一次 2 g）。按体重一次 40 mg/kg，每 12 小时静脉滴注 1 次，疗程 7 ~ 14 日。对细菌性脑脊髓膜炎儿童患者，可为 50 mg/kg，每 8 小时 1 次，静脉滴注。对儿童中性粒细胞减少伴发热经验治疗：50 mg/kg，每 12 小时 1 次（中性粒细胞减少伴发热的治疗为每 8 小时 1 次），疗程与成人相同。2 月龄以下儿童按体重 30 mg/kg，每 8 或 12 小时 1 次。2 月龄以下儿童慎用。③肝功能不全患者，无调节剂量的必要。④肾功能不全患者，其初始剂量与肾功能正常的患者相同，但维持剂量和给药间隔需按肌酐清除率（CCr）调整：CCr 为每分钟 30 ~ 60 ml 者，一次 0.5 ~ 1.0 g，每 12 小时 1 次，或一次 2 g，每 8 ~ 12 小时 1 次；CCr 为每分钟 11 ~ 29 ml 者，一次 0.5 ~ 1.0 g，每 24 小时 1 次，或一次 2 g，每 12 ~ 24 小时 1 次；CCr 每分钟 < 11 ml 者，一次 0.25 g，每 24 小时 1 次，或一次 0.5 ~ 1 g，每 24 小时 1 次。⑤接受持续性腹膜透析患者应每隔 48 小时给予常规剂量。⑥肾功能不全儿童患者的用法与成人类似。

【制剂与规格】注射用盐酸头孢吡肟：① 0.5 g；② 1.0 g。

头孢匹罗 [保（乙）]

Cefpirome

【适应证】用于由未知病原菌或对本品敏感菌引起的感染，如下呼吸道感染（支气管肺炎及大叶性肺炎），合并上及下泌尿道感染，皮肤与软组织感染（蜂窝织炎、皮肤脓肿及伤口感染），中性粒细胞减少患者的感染，菌血症／败血症

【注意事项】(1) 肾功能：本品与氨基糖苷类或襻利尿药合用时应给予注意。所有该类患者均应监测肾功能。(2) 肾功能不全时，应根据肌酐清除率调整剂量。(3) 假膜性结肠炎：一旦考虑到假膜性结肠炎的诊断，则应立即停止用药并开始特异性的抗生素治疗。(4) 应事先询问患者是否有 β- 内酰胺抗生素过敏史。(5) 交叉过敏：在青霉素过敏患者中使用头孢匹罗时应在特别谨慎的情况下进行。首次给药时有必要仔细观察。(6) 疗程超过 10 日时，则应监测血象。

【禁忌证】对头孢菌素过敏者、儿童、妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 超敏反应：过敏性皮肤反应：皮疹、荨麻疹、瘙痒、药物热；有可能发生严重的急性过敏反应；血管性水肿、支气管痉挛。(2) 对胃肠道的影响：恶心、呕吐、腹泻；罕见假膜性结肠炎。(3) 对肝功能的影响：血 ALT 及 AST、乳酸脱氢酶、胆红素升高。(4) 对肾功能的影响：可有血清肌酐及尿素的轻度增高，罕见急性肾衰竭发生。(5) 血液成分改变：血小板减少；嗜酸性粒细胞增多；极少见溶血性贫血。有可能发生中性粒细胞减少及更少见的中性粒细胞缺乏。(6) 局部反应：静脉壁炎性刺激及注射部位疼痛。(7) 神经系统影响：极少数病例发生惊厥。可发生可逆性脑病。(8) 双重感染：可能导致包括念珠菌在内的非敏感病原菌的过度生长。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注。下列剂量推荐用于肾功能正常的感染患者（表 9-7）。肾功能损害患者参考表 9-8 减少剂量。(1) 静脉注射：将 1 g 或 2 g 头孢匹罗分别溶解于 10 ml 或 20 ml 灭菌注射用水，然后在 3 ~ 5 分钟内将药液直接注入静脉内或夹闭的输液管道的远端部分。对肾功能损害患者，则可将 0.25 g 或 0.5 g 头孢匹罗分别溶解于 2 ml 或 5 ml 注射用水中。(2) 短时静脉滴注：将 1 g 或 2 g 头孢匹罗药粉溶于 50 ml 灭菌注射用水（或 0.9% 氯化钠注射液、林格注射液、标准电解质滴注液、5% 或 10% 葡萄糖注射液、5% 果糖注射液、6% 葡萄糖 + 0.9% 氯化钠注射液），在 20 ~ 30 分钟内滴毕。

【制剂与规格】注射用头孢匹罗：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

9.3.3 其他 β-内酰胺类

其他 β-内酰胺类抗生素还有：①头霉素类，亦有将其列入第二代头孢菌素者，但头霉素类对大多数超广谱 β-内酰胺酶稳定，且对拟杆菌属等厌氧菌具有抗菌活性，主要品种有头孢西丁、头孢美唑。②碳青霉烯类，具有抗菌谱广，抗菌活性强和对 β-内酰胺酶高度稳定的特点，主要品种为亚胺培南、美罗培南、帕尼培南、厄他培南等。这类药物常与可减轻其肾毒性的药物，如西司他汀或倍他米隆，制成复方制剂应用。③单酰胺菌素类，代表品种氨曲南，仅对需氧革兰阴性菌具有良好抗菌活性，不良反应少，与其他 β-内酰胺类药物交叉过敏少。④氧头孢烯类，代表品种为拉氧头孢和氟氧头孢等，目前临床上趋于少用。

上述药物与青霉素类、头孢菌素类药物可能存在交叉过敏反应，应用前必须详细询问患者对该品种、头孢菌素类、青霉素类或其他药物的过敏史。有青霉素过敏史患者，必须充分权衡利弊在确有适应证

表 9-7 肾功能正常患者头孢匹罗用药剂量

感 染	单次剂量 (g)	给药间隔 (小时)	单日总剂量 (g)
中重度合并上下泌尿道感染或皮肤及软组织感染	1.0	12	2.0
中重度下呼吸道感染	1.0 或 2.0	12	2.0 或 4.0
中重度菌血症／败血症及上述的严重感染或中性粒细胞减少患者的感染	2.0	12	4.0

表 9-8 肾功能损害患者头孢匹罗用药参考

肌酐清除率（每分钟毫升数）	肾功能正常者剂量
> 50	1 ~ 2 g，一日 2 次
肾功能损害患者，负荷量 1 ~ 2 g，然后剂量调整如下	
50 ~ 20	0.5 ~ 1 g，一日 2 次
20 ~ 5	0.5 ~ 1 g，一日 1 次
< 5（血液透析患者）	一日 0.5 ~ 1 g，透析后即刻 0.25 ~ 0.5 g

且严密观察下应用；有青霉素过敏性休克史患者宜避免应用。发生过敏性休克时的抢救参阅青霉素类。

头孢美唑[保(乙)]

Cefmetazole

【适应证】头孢美唑钠敏感的金黄色葡萄球菌、大肠埃希菌、肺炎杆菌、变形杆菌属、摩氏摩根菌、普罗威登斯菌属、消化链球菌属、拟杆菌属、普雷沃菌属（双路普雷沃菌除外）所引起的下述感染：①败血症。②急性支气管炎、肺炎、肺脓肿、脓胸、慢性呼吸道疾病。③继发感染。④膀胱炎、肾盂肾炎。⑤腹膜炎。⑥胆囊炎、胆管炎。⑦前庭大腺炎、子宫内感染、子宫附件炎、子宫旁组织炎。⑧颌骨周围蜂窝织炎、颌炎。

【注意事项】(1) 下述患者应慎用：①对青霉素类抗生素有过敏史者。②本人或双亲、兄弟姐妹等亲属属于过敏体质者。③严重肾损害者（有可能出现血药浓度升高、半衰期延长）。④经口摄食不足患者或非经口维持营养者、全身状态不良者（通过摄食，可能出现维生素 K 缺乏）。⑤高龄者。⑥对本品所含成分或头孢类抗生素有过敏史患者原则上不给药，不得不使用时应慎用。(2) 特别要注意的是，使用前应充分询问病史，尤其必须确认对抗生素的过敏史。(3) 给药期间及给药后至少1周内避免饮酒。(4) 孕妇或可能妊娠的妇女，仅在治疗的有益性超过危险性时方可给药。(5) 老年人慎用。

【禁忌证】对本品有过敏性休克史患者禁用。

【不良反应】(1) 罕见休克。(2) 有可能出现皮肤黏膜 - 眼综合征（Stevens-Johnson 综合征）、中毒性表皮坏死松解症（Lyell 综合征）。(3) 罕见出现伴有便血的抗生素相关性肠炎（低于 0.01%）。(4) 过敏反应：皮疹、瘙痒、荨麻疹、红斑、发热。(5) 血液系统：粒细胞减少、嗜酸性细胞增多，红细胞减少，血小板减少。(6) 肝脏功能：AST 及 ALT 升高、肝功能异常，ALP 升高。(7) 消化系统：恶心及呕吐、腹泻，食欲减退。(8) 菌群失调：口腔炎、念珠菌病。(9) 维生素缺乏症：维生素 K 缺乏（低凝血酶原血症、出血倾向等），B 族维生素缺乏（舌炎、口腔炎、食欲减退、神经炎等）。(10) 其他：头痛。

【用法与用量】(1) 用法：①静脉注射，1 g（效价）溶于灭菌注射用水、氯化钠注射液或葡萄糖注射液 10 ml 中，缓慢注入。②静脉滴注时，溶解静脉滴注剂时，不得用注射用水溶解（因溶液不呈等张）。③给药：静脉内大量给药时，可能会引起血管刺激性痛，故应充分注意注射液的配制、注射部位及注射方法等并尽量缓慢注入。④室温条件下溶解后的药品应 24 小时内用完。(2) 用量：①成人，一日 1 ~ 2 g（效价），分 2 次静脉注射或静脉滴注。②小儿，一日 25 ~ 100 mg（效价）/kg 体重，分 2 ~ 4 次静脉注射或者静脉滴注。③难治性或严重感染，可随症状将一日量成人增至 4 g（效价）、小儿增至按体重 150 mg（效价）/kg，分 2 ~ 4 次。④肾功能损害患者：按肌酐清除率调整。每分钟 > 60 ml 者，一次 1 g，每 12 小时给药 1 次；每分钟 30 ~ 60 ml 者，一次 1 g，每 24 小时给药 1 次，或一次 0.5 g，每 12 小时给药 1 次；每分钟 10 ~ 30 ml 者，一次 1 g，每 48 小时给药 1 次，或一次 0.25 g，每 12 小时给药 1 次；每分钟 < 10 ml 者，一次 1 g，每 120 小时给药 1 次，或一次 0.1 g，每 12 小时给药 1 次。

【制剂与规格】注射用头孢美唑钠：① 1 g；② 2 g。

氨曲南[保(乙)]

Aztreonam

【适应证】(1) 适用于治疗敏感需氧革兰阴性菌所致的各种感染，如尿路感染、下呼吸道感染、败血症、腹腔内感染、妇科感染、术后伤口及烧伤、溃疡等皮肤软组织感染等。(2) 亦用于治疗医院内感染中的上述类型感染（如免疫缺陷患者的医院内感染）。

【注意事项】(1) 氨曲南与青霉素之间无交叉过敏反应，但对青霉素、头孢菌素过敏及过敏体质者仍需慎用。(2) 氨曲南肝毒性低，但对肝功能已受损的患者应观察其动态变化。(3) 氨曲南可与氯霉素

磷酸酯、硫酸庆大霉素、硫酸妥布霉素、头孢唑啉钠、氨苄西林钠联合使用，但与萘夫西林、头孢拉定、甲硝唑有配伍禁忌。(4) 有不同程度的抗生素相关性肠炎。(5) 氨曲南能通过胎盘进入胎儿循环，虽然动物实验显示其对胎儿无影响、无毒性和无致畸作用，但缺乏在妊娠妇女中进行的充分良好对照的临床研究，对妊娠妇女或有妊娠可能性的妇女，仅在必要时方可给药。(6) 氨曲南可经乳汁分泌，浓度不及母体血药浓度的 1%，哺乳妇女使用时应暂停哺乳。(7) 婴幼儿的安全性尚未确立，应慎用。(8) 老年人用药剂量应按其肾功能减退情况酌情减量。

【不良反应】(1) 消化道反应：常见为恶心、呕吐、腹泻及皮肤过敏反应。(2) 其他：白细胞计数降低、血小板减少、难辨梭菌腹泻、胃肠出血、剥脱性皮炎、低血压、一过性心电图变化、肝胆系统损害、中枢神经系统反应及肌肉疼痛等较罕见。(3) 静脉给药偶见静脉炎，肌内注射可产生局部不适或肿块，发生率为 1.9% ~ 2.4%。

【禁忌证】对氨曲南有过敏史者禁用。

【用法与用量】(1) 用法：静脉滴注、静脉注射、肌内注射。①静脉滴注：每 1 g 氨曲南至少用注射用水 3 ml 溶解，再用适当输液（0.9% 氯化钠注射液、5% 或 10% 葡萄糖注射液或林格注射液）稀释，氨曲南浓度不得超过 2%，滴注时间 20 ~ 60 分钟。②静脉注射：每瓶用注射用水 6 ~ 10 ml 溶解，于 3 ~ 5 分钟缓慢注入静脉。③肌内注射：每 1 g 至少用注射用水或氯化钠注射液 3 ml 溶解，深部肌内注射。(2) 用量：成人。①尿路感染：一次 0.5 g 或 1 g，每 8 或 12 小时 1 次。②中重度感染：一次 1 g 或 2 g，每 8 或 12 小时 1 次。③危及生命或铜绿假单胞菌严重感染：一次 2 g，每 6 或 8 小时 1 次。④单次剂量大于 1 g 时或患败血症、其他全身严重感染或危及生命的感染，应静脉给药，最高剂量一日 8 g。⑤患者有短暂或持续肾功能减退时：宜根据肾功能情况，酌情减量。对肌酐清除率每分钟小于 10 ~ 30 ml 的肾功能损害者，首次用量 1 g 或 2 g，以后用量减半。依靠血液透析的肾功能严重衰竭者，首次用量 0.5 g、1g 或 2g，维持量为首次剂量的 1/4，间隔时间为 6、8 或 12 小时。对严重或危及生命的感染者，一次血液透析后，在原有的维持量上增加首次用量的 1/8。

【制剂与规格】注射用氨曲南：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

舒巴坦[保(乙)]

Sulbactam

【适应证】与氨苄西林联合应用，用于治疗敏感菌所致的尿路感染、肺部感染、支气管感染、耳鼻喉科感染、腹腔和盆腔感染、胆道感染、败血症、皮肤软组织感染等。

【注意事项】(1) 本品必须和 β-内酰胺类抗生素联合使用，单独使用无效。(2) 当与青霉素类药物合用时，用药前须做青霉素皮肤试验，阳性者禁用。(3) 交叉过敏反应：对一种青霉素类抗生素过敏者可能对其他青霉素类抗生素也过敏。(4) 肾功能减退者，根据血浆肌酐清除率调整用药，见表 9-9。(5) 本品配成溶液后必须及时使用，不宜久置。(6) 对诊断的干扰：①用药期间，以硫酸铜法进行尿糖测定时可出现假阳性，用葡萄糖酶法者则不受影响；②大剂量注射给药可出现高钠血症；③可使血清 ALT 或 AST 升高。(7) 应用大剂量时应定期检测血清钠。(8) 妊娠及哺乳期妇女应用仍须权衡利弊。(9) 老年患者肾功能减退，须调整剂量。

表 9-9 肾功能减退患者舒巴坦用药参考

血浆肌酐清除率（每分钟毫升数）	半衰期（小时）	给药间期（小时）
≥ 30	1	6 ~ 8
15 ~ 29	5	12
5 ~ 14	9	24

【禁忌证】对青霉素类药物过敏者禁用。

【不良反应】注射部位疼痛、皮疹，静脉炎、腹泻、恶心等反应偶有发生。偶见一过性嗜酸性粒细胞增多，血清 ALT、AST 升高等。极个别患者发生剥脱性皮炎、过敏性休克。

【用法与用量】本品与氨苄西林以1：2剂量比应用时：一般感染，成人剂量为一日舒巴坦1～2g，氨苄西林2～4g，分2～3次静脉滴注或肌内注射；轻度感染，亦可一日舒巴坦0.5g，氨苄西林1g，分2次静脉滴注或肌内注射；重度感染，可增大剂量至一日舒巴坦3～4g，氨苄西林6～8g，分3～4次静脉滴注。舒巴坦最高剂量不超过一日4g。

【制剂与规格】注射用舒巴坦钠：①0.25g；②0.5g；③1.0g（以舒巴坦计）。

亚胺培南－西司他丁[保(乙)]

Imipenem-Cilastatin

【适应证】用于亚胺培南－西司他丁为一非常广谱的抗生素，适用于多种病原体所致和需氧／厌氧菌引起的混合感染及在病原菌未确定前的早期治疗。适用于由敏感细菌所引起的下列感染。①腹腔内感染。②下呼吸道感染。③妇科感染。④败血症。⑤泌尿生殖道感染。⑥骨关节感染。⑦皮肤软组织感染。⑧心内膜炎。⑨不适用于脑膜炎的治疗。⑩适用于预防已经污染或具有潜在污染性外科手术患者的术后感染。

【注意事项】(1) 使用前，应详细询问患者过去有无对β－内酰胺抗生素的过敏史。亚胺培南－西司他丁静脉滴注不能与其他抗生素混合或直接加入其他抗生素中使用。(2) 患过胃肠道疾病尤其是结肠炎的患者，需慎用。对在使用过程中出现腹泻的患者，应考虑抗生素相关性肠炎的可能。(3) 中枢神经系统：静脉滴注制剂可产生中枢神经系统的不良反应，如肌肉阵挛、精神错乱或癫痫发作。大多发生于已有中枢神经系统疾患的患者（如脑损害或有癫痫病史）和（或）肾功能损害者。(4) 肌酐清除率每分钟≤5ml的患者不应使用，除非在48小时内进行血液透析。血液透析患者亦仅在使用亚胺培南－西司他丁的益处大于诱发癫痫发作的危险性时才可考虑。(5) 尚无足够的妊娠妇女使用本品的研究资料，只有考虑在对胎儿益处大于潜在危险的情况下，才能在妊娠期间给药。(6) 在人乳中可测出亚胺培南，如确定有必要对哺乳期妇女使用本品时，患者需停止授乳。(7) 尚无足够的临床资料可推荐用于3个月以下的婴儿或肾功能损害（血肌酐＞2mg/dl）的儿科患者。

【不良反应】(1) 局部反应：红斑、局部疼痛和硬结，血栓性静脉炎。(2) 过敏反应／皮肤：皮疹、瘙痒、荨麻疹、多形性红斑、Stevens-Johnson综合征、血管性水肿、中毒性表皮坏死（罕见）、表皮脱落性皮炎（罕见）、念珠菌病、包括药物热及过敏反应。(3) 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹泻、牙齿和（或）舌色斑。已报道使用其他所有广谱抗生素均可引起抗生素相关性肠炎。(4) 血液：嗜酸性粒细胞增多症、白细胞减少症、中性白细胞减少症，包括粒细胞缺乏症，血小板减少症、血小板增多症和血红蛋白降低，以及凝血酶原时间延长均有报道。(5) 肝功能：ALT及AST、胆红素和（或）血清碱性磷酶升高；肝炎（罕见）。(6) 肾功能：少尿／无尿、多尿、急性肾衰竭（罕见）。由于这些患者通常已有导致肾前性氮质血症或肾功能损害的因素，因此难以评估本品对肾功能改变的作用。(7) 可引起血清肌酐和血尿素氮升高的现象；尿液变色的情况是无害的，不应与血尿混淆。(8) 神经系统／精神疾病：已有报道静脉滴注本品可引起中枢神经系统的不良反应，如肌阵挛、精神障碍，包括幻觉、错乱状态或癫痫发作，感觉异常亦有报道。(9) 特殊感觉：听觉丧失，味觉异常。(10) 在粒细胞减少的患者中使用，常出现药物相关性的恶心和（或）呕吐症状。(11) 静脉滴注用的亚胺培南－西司他丁250mg内含钠18.8mg（0.8mEq）；而静脉滴注用的本品500mg则含钠37.5mg(1.6mEq)。

【禁忌证】本品禁用于对本品任何成分过敏的患者。

【用法与用量】静脉滴注：(1) 成人：①轻度感染，一次250mg，每6小时1次，一日总量1g。②中度感染，一次0.5～1g，每12小时1次，一日总量1.5～2.0g。③严重感染，一次0.5g，每6小时1次，一日总量2g。④不太敏感菌所引起的严重感染：一次1g，每6～8小时1次，一日总量3～4g。一次静脉滴注的剂量≤

500 mg 时，静脉滴注时间应不少于 20 ~ 30 分钟，如剂量＞ 500 mg 时，静脉滴注时间应不少于 40 ~ 60 分钟。肾功能损害和体重轻的患者需按肌酐清除率调整剂量和用药间隔时间。每分钟 41 ~ 70 ml 者，一次 250 mg，每 6 ~ 8 小时 1 次，一日总量 1 ~ 1.5 g；或一次 500 mg，每 6 ~ 8 小时 1 次，一日总量 2 ~ 3 g；或一次 750 mg，每 8 小时 1 次，一日总量 4 g。每分钟 21 ~ 40 ml 者，一次 250 mg，每 8 ~ 12 小时 1 次，一日总量 2 g、1.5 g、1 g；或一次 500 mg，每 6 ~ 8 小时 1 次，一日总量 3 ~ 4 g。每分钟 6 ~ 20 ml 者，一次 250 mg，每 12 小时 1 次，一日总量 1 ~ 2 g；或一次 500 mg，每 12 小时 1 次，一日总量 3 ~ 4 g。每分钟≤ 5 ml/1.73 m^2 时，除非患者在 48 小时内进行血液透析，否则不应给予本品。预防成人的手术后感染，可在诱导麻醉时给予本品静脉滴注 1 000 mg，3 小时后再给予 1 000 mg。对预防高危性（如结肠直肠）外科手术的感染，可在诱导后 8 小时和 16 小时分别再给予 500 mg 静脉滴注。(2) 儿童：①儿童体重≥ 40 kg，可按成人剂量给予。②儿童和婴儿体重＜ 40 kg 者，可按 15 mg/kg，每 6 小时 1 次给药。每日总剂量不超过 2 g。③对 3 个月以内的婴儿或肾功能损害的儿科患者（血清肌酐＞ 2 mg/dl），尚无足够的临床资料作为推荐依据。

【制剂与规格】注射用亚胺培南 - 西司他丁钠（1∶1）：① 0.5 g；② 1.0 g；③ 2.0 g。

美罗培南 [保（乙）]

Meropenem

【适应证】用于由单一或多种敏感细菌引起的成人及儿童的下列感染：①肺炎及院内获得性肺炎。②尿路感染。③腹腔内感染。④妇科感染（例如子宫内膜炎）。⑤皮肤及软组织感染。⑥脑膜炎。⑦败血症。

【注意事项】(1) 美罗培南与其他碳青霉烯类和 β - 内酰胺类抗生素、青霉素和头孢菌素局部交叉过敏反应。(2) 严重肾功能障碍的患者，需根据其肌酐清除率调节用量；严重肝功能障碍的患者，有可能加重肝功能障碍。(3) 进食不良或全身状况不良的患者，有可能引起维生素 K 缺乏症状。(4) 有癫痫史或中枢神经系统功能障碍的患者，发生痉挛、意识障碍等中枢神经系统症状的可能性增加。(5) 有时会出现 AST 及 ALT 升高，连续给药 1 周以上或有肝脏疾病的患者，应进行肝功能检查。(6) 尚未确立本品在妊娠期给药的安全性，当判断利大于弊时，才可用于妊娠期或有可能妊娠的妇女。给药期间应避免哺乳。(7) 用于老年人时，可因生理功能下降或维生素 K 缺乏而应慎用。

【禁忌证】(1) 对本品及其他碳青霉烯类抗生素有过敏史的患者。(2) 使用丙戊酸钠的患者。

【不良反应】(1) 严重不良反应：（发生率＜ 0.1%）可能有过敏性休克，急性肾衰竭等严重肾功能障碍，抗生素相关性肠炎等，间质性肺炎、PIE 综合征，痉挛、意识障碍等中枢神经系统症状，Lyell 综合征（＜ 0.1%）、Stevens-Johnson 综合征，全血细胞减少、无粒细胞症、溶血性贫血、白细胞减少、血小板减少，肝功能障碍、黄疸（＜ 0.1%），血栓性静脉炎。(2) 其他不良反应：①过敏反应，如皮疹、荨麻疹、红斑、瘙痒、发热、发红等及发热感；②血液系统，如粒细胞减少、嗜酸性粒细胞增多、血小板增多或减少、红细胞减少、血红蛋白降低等，嗜碱性粒细胞增多、血细胞比容降低、淋巴细胞增多等；③肝，如 AST、ALT、LDH、Al-P、LAP、γ-GTP、胆红素、尿胆素原升高，胆碱酯酶降低等，黄疸；④肾，如 BUN、Cr 升高，尿中 β_2 微球蛋白升高；⑤消化系统，如腹泻、恶心、呕吐、腹痛、食欲减退；⑥二重感染，如口腔黏膜炎、念珠菌感染；⑦维生素缺乏症，如维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原血症、出血倾向等）、B 族维生素缺乏症状（舌炎、口腔黏膜炎、食欲下降、神经炎等）；⑧其他，如血清钙升高、头痛、倦怠感、不稳、肌阵挛、谵妄。

【用法与用量】注射给药：(1) 成人剂量：根据感染的类型和严重程度而决定，肺炎、尿路感染、妇科感染，如子宫内膜

炎、皮肤及附属器感染，一次 0.5 g，每 8 小时 1 次；院内获得性肺炎、腹膜炎、推定有感染的中性粒细胞减低患者及败血症，一次 1.0 g，每 8 小时 1 次；脑膜炎，一次 2 g，每 8 小时 1 次。肾功能障碍患者，肌酐清除率每分钟 < 50 ml 者，应减少给药剂量或延长给药间隔。(2) 儿童剂量：3 个月至 12 岁的儿童，一次 10 ~ 20 mg/kg，每 8 小时 1 次。体重大于 50 kg 的儿童，按照成人剂量给药。脑膜炎，一次 40 mg/kg，每 8 小时 1 次。

【制剂与规格】注射用美罗培南：① 0.25 g；② 0.5 g。

比阿培南[保(乙)]

Biapenem

【适应证】用于对本品敏感细菌所引起的败血症、肺炎、肺部脓肿、慢性呼吸道疾病引起的二次感染、难治性膀胱炎、肾盂肾炎、腹膜炎、妇科附件炎等。

【注意事项】(1) 应用前应仔细询问对青霉素、碳青霉烯类及头孢类抗生素药物过敏史，对上述药品过敏者慎用。(2) 本人或直系亲属有易诱发支气管哮喘、皮疹、荨麻疹等症状的过敏性体质者慎用。(3) 严重的肾功能不全者慎用，肾功能不全者可按肌酐清除率调整剂量。(4) 老年患者慎用。(5) 进食困难及全身状况恶化者，可能会出现维生素 K 缺乏症状，应注意观察。(6) 有癫痫史者及中枢神经系统疾病患者慎用。

【不良反应】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见皮疹、瘙痒、恶心、呕吐及腹泻等。

【用法与用量】将 0.3 g 本品溶解于 100 ml 0.9% 氯化钠注射液或葡萄糖注射液中静脉滴注。成人，一日 0.6 g，分 2 次滴注，一次 30 ~ 60 分钟。可根据患者年龄、症状适当增减给药剂量。但单日最大给药量不能超过 1.2 g。

【制剂与规格】注射用比阿培南：0.3 g。

法罗培南[保(乙)]

Faropenem

【适应证】用于由葡萄球菌、链球菌、肺炎球菌、肠球菌、卡他莫拉克菌、大肠埃希菌、柠檬酸杆菌、克雷伯杆菌、肠杆菌、奇异变形杆菌、流感嗜血杆菌、消化链球菌、痤疮丙酸杆菌、拟杆菌等敏感菌所致的下列感染：①泌尿系统感染：肾盂肾炎、膀胱炎、前列腺炎、睾丸炎；②呼吸系统感染：咽喉炎、扁桃体炎、急慢性支气管炎、肺炎、肺脓肿（肺脓肿病）；③子宫附件炎、子宫内感染、前庭大腺炎；④浅表性皮肤感染症、深层皮肤感染症，痤疮（伴有化脓性炎症）；⑤淋巴管炎、淋巴结炎、乳腺炎、肛周脓肿、外伤、烫伤和手术创伤等继发性感染；⑥泪囊炎、睑腺炎、睑板腺炎、角膜炎（含角膜溃疡）；⑦外耳炎、中耳炎、鼻窦炎；⑧牙周组织炎、牙周炎、腭炎。

【注意事项】(1) 对青霉素类、头孢菌素类或碳青霉烯类药有过敏史者慎用。(2) 本人或亲属为易于发生支气管哮喘、发疹、荨麻疹等过敏反应体质者慎用。(3) 经口摄取不良的患者或正接受非口服营养疗法患者、全身状态不良患者（有时会出现维生素 K 缺乏症）慎用。(4) 对妊娠期妇女或可疑妊娠妇女慎用。使用本药期间避免哺乳。(5) 老年患者可能发生维生素 K 缺乏所致出血倾向。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 常见腹泻、腹痛、稀便、发疹、恶心、ALT 及 AST 升高、嗜酸性粒细胞增多。(2) 偶见休克、过敏性样症状、急性肾功能不全、假膜性肠炎、皮肤黏膜眼综合征、中毒性表皮坏死症、间质性肺炎、肝功能不全、黄疸、粒细胞缺乏症、横纹肌溶解症。

【用法与用量】口服：(1) 用于浅表性皮肤感染症、深层皮肤感染症、淋巴结炎、慢性脓皮病，乳腺炎、肛周脓肿、外伤、烫伤和手术创伤等(浅表性)二次感染，咽喉炎、急慢性支气管炎、扁桃体炎，子宫附件炎、子宫内感染、前庭大腺炎，眼睑炎、睑腺炎、泪囊炎、睑板腺炎、角膜炎、角膜溃疡，外耳炎、牙周组织炎、牙周炎、腭炎等，成人一次 150 ~ 200 mg，一日 3 次。(2) 用于肺炎、肺脓肿、肾盂肾炎、膀胱炎（除单纯性膀胱炎外）、前列腺炎、睾丸炎、中耳炎、鼻窦炎等，成

人一次 200 ~ 300 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】法罗培南钠片：0.2 g。法罗培南钠胶囊：0.1 g。

帕尼培南倍他米隆[保(乙)]

Panipenem Betamipron

本品为复方制剂，其组分为帕尼培南和倍他米隆。帕尼培南为抗菌成分，倍他米隆通过阻断帕尼培南向肾皮质转运减少其肾毒性。

【适应证】对本品敏感的葡萄球菌属、链球菌属、肠球菌属、消化链球菌属、黏膜炎卡他布兰汉球菌、大肠埃希菌、柠檬酸细杆菌属、克雷伯杆菌属、肠杆菌属、沙雷菌属、变形杆菌属、摩根菌属、普罗威登斯菌属、假单孢菌属、流感杆菌、类杆菌属所引起的感染：①败血症、感染性心内膜炎。②丹毒、蜂窝织炎、淋巴管（结）炎。③肛门周围脓肿、外伤和烧伤以及手术创伤等的表面性二次感染、骨髓炎、关节炎。④咽喉炎（咽喉脓肿）、急性支气管炎、扁桃体炎（扁桃体周围炎、扁桃体周脓肿）、慢性支气管炎、支气管扩张症（感染时）、慢性呼吸道疾患继发感染、肺炎、肺化脓症、脓胸。⑤肾盂肾炎、膀胱炎、前列腺炎、附睾炎。胆囊炎、胆管炎、肝脓肿。⑥腹膜炎、盆腔腹膜炎、道格拉斯脓肿。⑦子宫附件炎、子宫内感染、子宫旁结合织炎、前庭大腺炎。⑧脑膜炎。眼窝感染、全眼球炎（包括眼内炎）。⑨中耳炎、鼻旁窦炎、化脓性唾液腺炎。⑩颌炎、颚骨周围蜂窝织炎。

【注意事项】(1) 既往对碳青霉烯类、青霉素类及头孢菌素类等抗生素有过敏体质者，严重肾功能损害患者，经口摄食品不足患者或非经口维持营养患者，全身状态不良者需慎用。此外，推荐使用前进行皮试。(2) 老年人使用本品时血中浓度有增高趋势。并可能发生因维生素 K 缺乏而致的出血倾向。(3) 早产儿、新生儿及孕妇不宜应用。(4) 本品禁止与丙戊酸钠合并使用。(5) 帕尼培南分解后可能使尿呈茶色。(6) 本品溶解后应立即使用。溶解液呈无色至澄明微黄色，这对于药效无影响。此外，在不得已需要保存时，应在室温下保存 6 小时之内使用。

【禁忌证】既往对本品的成分发生过休克反应或正在使用丙戊酸钠的患者。

【不良反应】(1) 腹泻、恶心、呕吐，肝功能损害，皮疹，抽搐等。(2) 临床检验值异常，如 ALT 及 AST 上升，嗜酸性粒细胞增多等。偶见较严重的不良反应，如休克、皮肤黏膜综合征、中毒性表皮坏死松解症、急性肾功能不全、意识障碍、假膜性肠炎、嗜酸性粒细胞增多、粒细胞缺乏症、全血细胞减少症、溶血性贫血、间质性肺炎等。

【用法与用量】静脉滴注：成人，一日 1 g（按帕尼培南计，下同），分 2 次给药，一次静脉滴注 30 分钟以上；重症或难治愈的感染症患者，可增至一日 2 g，分 2 次用药。儿童，一日按体重 30 ~ 60 mg/kg（按帕尼培南计，下同），分 3 次给药，一次静脉滴注 30 分钟以上，重症或难治愈的感染症患者，可增至一日 100 mg/kg，分 3 ~ 4 次给药，一日不得超过 2 g。

【制剂与规格】注射用帕尼培南倍他米隆（1∶1）：① 0.5 g；② 1.0 g。

厄他培南

Ertapenem

【适应证】成人由下述细菌的敏感菌株引起的下列中度至重度感染：①继发性腹腔感染，由大肠埃希菌、梭状芽胞杆菌、迟缓真杆菌、消化链球菌属、脆弱拟杆菌、吉氏拟杆菌、卵形拟杆菌、多形拟杆菌或单形拟杆菌引起者。②复杂性皮肤及附属器感染，由金黄色葡萄球菌（仅指对甲氧西林敏感菌株）、化脓性链球菌、大肠埃希菌或消化链球菌属引起者。③社区获得性肺炎，由肺炎链球菌（仅指对青霉素敏感的菌株，包括合并菌血症的病例）、流感嗜血杆菌（仅指 β - 内酰胺酶阴性菌株）或卡他莫拉球菌引起者。④复杂性尿道感染，包括肾盂肾炎，由大肠埃希菌或肺炎克雷伯杆菌引起者。⑤急性盆腔感染，包括产后子宫内膜炎、流产感染和妇产科术后感染，由无乳链球菌、大肠埃希菌、脆弱拟杆菌、不解糖卟啉单胞菌、消化链球菌属或双路普雷沃菌属引起者。⑥菌血症。

【注意事项】(1) 治疗以前，必须向

患者仔细询问有关对青霉素、头孢菌素、其他 β-内酰胺类抗生素及其他过敏原的过敏情况。(2) 延长使用时间可能会导致非敏感细菌的过量生长。发生二重感染，如引发抗生素相关性肠炎等。(3) 肌内注射本品时应避免误将药物注入血管。(4) 有可能出现癫痫发作。这种现象在患有神经系统疾患（如脑部病变或有癫痫发作史）和（或）肾功能受到损害的患者中最常发生。(5) 尚未在孕妇中进行过对照的研究。只有当潜在的益处超过对母亲和胎儿的潜在危险时，才能在妊娠期间使用。哺乳期妇女慎用。(6) 对儿童的安全性和疗效尚不明确，不推荐小于 18 岁的患者使用。(7) 厄他培南经肠外给药治疗的患者中有≥ 1.0% 出现实验室检查结果异常 (CLSA)：① ALT、AST、血清直接胆红素、血清碱性磷酸酶、血清肌酐、血清总胆红素、嗜酸性细胞、血清间接胆红素、PTT、尿中的细菌、BUN、血清葡萄糖、单核细胞、尿中的上皮细胞和尿中的红细胞升高；②多形核中性粒细胞、白细胞、血细胞比容、血红蛋白及血小板计数下降。

【禁忌证】(1) 对本品中任何成分或对同类的其他药物过敏者。(2) 由于使用盐酸利多卡因作为稀释剂，所以对酰胺类局麻药过敏的患者、伴有严重休克或心脏传导阻滞的患者禁止肌内注射本品。

【不良反应】(1) 最常见有：腹泻、输药静脉的并发症、恶心和头痛。(2) 常见的有：头痛；静脉炎、血栓性静脉炎；腹泻、恶心、呕吐；皮疹；阴道炎。(3) 偶见的有：头晕，嗜睡，失眠，癫痫发作，精神错乱，低血压，呼吸困难，口腔念珠菌病，便秘，反酸，与艰难梭状芽胞杆菌相关的腹泻，口干，消化不良，食欲缺乏，红斑，瘙痒，全身不适及给药部位的异常（如腹痛，味觉倒错，无力／疲劳，念珠菌病，水肿／肿胀，发热，疼痛，胸痛），阴道瘙痒，变态反应，真菌感染。(4) 罕见的有：过敏样反应、幻觉。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：不得与其他药物混合滴注，不得使用含有葡萄糖的稀释液。应在药物溶解后 6 小时内用完。(2) 肌内注射：必须在给药前用 1.0% 盐酸利多卡因注射液 3.2 ml（不得含有肾上腺素）溶解后，立即做深部肌内注射。须在药物溶解后 1 小时内使用，此溶液不得静脉给药。成人：为一次 1 g，一日 1 次。继发性腹腔内感染，疗程 5 ~ 14 日；复杂性皮肤及附属器感染：疗程 7 ~ 14 日；社区获得性肺炎和复杂性尿路感染：每天 1 g，一日 1 次，疗程 10 ~ 14 日；急性盆腔感染（包括产后子宫内膜炎、流产感染和妇产科术后感染）：疗程 3 ~ 10 日。严重肾功能不全患者，肌酐清除率每分钟≤ 30 ml）及终末期肾功能不全（肌酐清除率每分钟＜ 10 ml 患者），需将剂量调整为一日 500 mg。

【制剂与规格】注射用厄他培南钠：1 g。

9.3.4 氨基糖苷类

常用的氨基糖苷类抗生素主要有链霉素、庆大霉素、妥布霉素、奈替米星、阿米卡星等。其共同特点为：①抗菌谱广，除链霉素外对葡萄球菌属、需氧革兰阴性杆菌均有良好抗菌作用，多数品种对铜绿假单胞菌亦具抗菌活性；其中链霉素、阿米卡星对结核分枝杆菌和其他分枝杆菌属亦有良好作用。②主要作用机制为抑制细菌蛋白质的合成。③细菌对不同品种间有部分或完全交叉耐药。④具有不同程度的肾毒性和耳毒性，后者包括前庭功能损害及（或）听力减退，并可有神经肌肉接头阻滞作用。⑤胃肠道吸收差，用于治疗全身性感染时必须注射给药。应根据肾功能损害的程度调整剂量，因大部分药物经肾脏以原型排出，肾功能减退时其消除半衰期显著延长。有条件时可经血药浓度监测，调整给药方案。⑥治疗急性感染通常疗程不宜超过 7 ~ 14 日。本类药物静脉给药时不宜与其他药物同瓶滴注。

链霉素 [基（基），保（甲）]

Streptomycin

【适应证】(1) 与其他抗结核药联合用于结核分枝杆菌所致各种结核病的初治病例，或其他敏感分枝杆菌感染。(2) 单用于治疗土拉菌病，或与其他抗菌药物联合用于鼠疫、腹股沟肉芽肿、布氏杆菌病、鼠咬热等的治疗。(3) 与青霉素或氨苄西

林联合治疗草绿色链球菌或肠球菌所致的心内膜炎。

【注意事项】(1) 交叉过敏。对一种氨基糖苷类过敏的患者可能对其他氨基糖苷类也过敏。(2) 下列情况应慎用链霉素：①失水，可使血药浓度增高，易产生毒性反应。②第Ⅷ对脑神经损害，因本品可导致前庭神经和听神经损害。③重症肌无力或帕金森病，因本品可引起神经肌肉阻滞作用，导致骨骼肌软弱。④肾功能损害，因本品具有肾毒性。(3) 疗程中应注意定期进行下列检查：①尿常规和肾功能测定，以防止出现严重肾毒性反应。②听力检查或高频听力测定，尤其是老年患者。(4) 对诊断的干扰：本品可使 ALT 及 AST、血清胆红素浓度及乳酸脱氢酶浓度的测定值增高；血钙、镁、钾、钠浓度的测定值可能降低。(5) 链霉素虽对孕妇有危害，但用药后有时可能利大于弊；链霉素可穿过胎盘进入胎儿组织，可能引起胎儿听力损害。因此妊娠妇女在使用前必须充分权衡利弊。哺乳期妇女用药期间宜暂停哺乳。(6) 在儿科中应慎用，尤其早产儿及新生儿的肾脏组织尚未发育完全，使本类药物的半衰期延长，药物易在体内积蓄而产生毒性反应。(7) 老年患者的肾功能有一定程度生理性减退，即使肾功能测定值在正常范围内仍应采用较小治疗量。老年患者应用氨基糖苷类后易产生各种毒性反应，应尽可能在疗程中监测血药浓度。

【禁忌证】对链霉素或其他氨基糖苷类过敏的患者禁用。

【不良反应】(1) 血尿、排尿次数减少或尿量减少、食欲减退、口渴等肾毒性症状，少数可产生血液中尿素氮及肌酐值增高。(2) 影响前庭功能时可有步履不稳、眩晕等症状；影响听神经出现听力减退、耳鸣、耳部饱满感。(3) 部分患者可出现面部或四肢麻木、针刺感等周围神经炎症状。(4) 偶可发生视力减退（视神经炎），嗜睡、软弱无力、呼吸困难等神经肌肉阻滞症状。(5) 偶可出现皮疹、瘙痒、红肿。少数患者停药后仍可发生听力减退、耳鸣、耳部饱满感等耳毒性症状，应引起注意。

【用法与用量】(1) 成人常用量：①肌内注射，一次 0.5 g，每 12 小时 1 次，与其他抗菌药物合用；细菌性（草绿色链球菌）心内膜炎，肌内注射，每 12 小时 1 g，与青霉素合用，连续 1 周，继以每 12 小时 0.5 g，连续 1 周；60 岁以上的患者应减为每 12 小时 0.5 g，连续 2 周；②肠球菌性心内膜炎，肌内注射，与青霉素合用，每 12 小时 1 g，连续 2 周，继以每 12 小时 0.5 g，连续 4 周；③鼠疫，肌内注射，一次 0.5 ~ 1 g，每 12 小时 1 次，与四环素合用，疗程 10 日；④土拉菌病，肌内注射，每 12 小时 0.5~1 g，连续 7 ~ 14 日；⑤结核病，肌内注射，每 12 小时 0.5 g，或 1 次 0.75 g，一日 1 次，与其他抗结核药合用；如采用间歇疗法，即一周给药 2 ~ 3 次，一次 1 g；老年患者肌内注射，一次 0.5 ~ 0.75 g，一日 1 次；⑥布氏杆菌病，一日 1 ~ 2 g，分 2 次肌内注射，与四环素合用，疗程 3 周或 3 周以上。(2) 小儿常用量：①肌内注射，按体重一日 15 ~ 25 mg/kg，分 2 次给药；②治疗结核病，按体重 20 mg/kg，一日 1 次，一日最大剂量不超过 1 g，与其他抗结核药合用。(3) 肾功能减退患者：按肾功能正常者的剂量为一次 15 mg/kg，一日 1 次，根据其肌酐清除率进行调整：每分钟＞50 ~ 90 ml 者，每 24 小时给予正常剂量的 50%；每分钟 10 ~ 50 ml 者，每 24 ~ 72 小时给正常剂量的 50%；每分钟＜10 ml 者，每 72 ~ 96 小时给予正常剂量的 50%。

【制剂与规格】注射用硫酸链霉素（以链霉素计）：① 0.75 g（75 万 U）；② 1 g（100 万 U）；③ 2 g（200 万 U）；④ 5 g（500 万 U）。

庆大霉素[基（基），保（甲/乙）]

Gentamycin

【适应证】(1) 敏感革兰阴性杆菌，如大肠埃希菌、克雷伯菌属、肠杆菌属、变形杆菌属、沙雷菌属、铜绿假单胞菌以及葡萄球菌甲氧西林敏感株所致的严重感染，如败血症、下呼吸道感染、肠道感染、盆腔感染、腹腔感染、皮肤软组织感染、复杂性尿路感染等。治疗腹腔感染及盆腔感染时应与抗厌氧菌药物合用。与青霉素（或氨苄西林）合用可治疗肠球菌属感染。

(2) 敏感细菌所致中枢神经系统感染，如脑膜炎、脑室炎时，可同时用本品鞘内注射作为辅助治疗。

【注意事项】(1) ~ (7) 见链霉素注意事项的 (1) ~ (7)。(8) 有条件时疗程中应监测血药浓度，并据以调整剂量，尤其对新生儿、老年和肾功能减退患者。每8小时1次给药者有效血药浓度应保持在4~10 μg/ml，避免峰浓度超过12 μg/ml，谷浓度保持在1~2 μg/ml；每24小时1次给药者血药峰浓度应保持在16 ~ 24 μg/ml，谷浓度应 <1 μg/ml。接受鞘内注射者应同时监测脑脊液内药物浓度。不能测定血药浓度时，应根据测得的肌酐清除率调整剂量。(9) 给予首次饱和剂量 (1 ~ 2 mg/kg) 后，有肾功能不全、前庭功能或听力减退的患者所用维持量应酌减。(10) 长期应用可能导致耐药菌过度生长。(11) 不宜用于皮下注射。(12) 本品有抑制呼吸作用，不得静脉注射。

【禁忌证】对本品或其他氨基糖苷类过敏者禁用。

【不良反应】(1) 用药过程中可能引起听力减退、耳鸣或耳部饱满感等耳毒性反应，影响前庭功能时可发生步履不稳、眩晕。也可能发生血尿、排尿次数显著减少或尿量减少、食欲减退、极度口渴等肾毒性反应。发生率较低者有因神经肌肉阻滞或肾毒性引起的呼吸困难、嗜睡、软弱无力等。偶有皮疹、恶心、呕吐、肝功能减退、白细胞减少、粒细胞减少、贫血、低血压等。(2) 少数患者停药后可发生听力减退、耳鸣或耳部饱满感等耳毒性症状，应引起注意。(3) 全身给药合并鞘内注射可能引起腿部抽搐、皮疹、发热和全身痉挛等。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一日 240 ~ 640 mg，分4次服用。②儿童，按体重一日 5 ~ 10 mg/kg，分4次服用。(2) 肌内注射或稀释后静脉滴注：①成人，一次 80 mg (8万U)，或按体重一次 1 ~ 1.7 mg/kg，每8小时1次；或一次 5 mg/kg，每24小时1次。疗程为7~14日。滴注时将一次剂量加入 50 ~ 200 ml 的氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液中，一日1次滴注时加入的液体量应不少于 300 ml，使药液浓度不超过 0.1%，该溶液应在 30 ~ 60 分钟缓慢滴入，以免发生神经肌肉阻滞作用。②儿童：肌内注射或稀释后静脉滴注，一次 2.5 mg/kg，每12小时1次；或一次 1.7 mg/kg，每8小时1次，疗程为7 ~ 14日，期间应尽可能监测血药浓度，尤其新生儿或婴儿。③鞘内及脑室内给药：成人，一次 4 ~ 8 mg，小儿 (3个月以上)，一次 1 ~ 2 mg，每2 ~ 3日1次。注射时将药液稀释至不超过 0.2% 的浓度，抽入 5 ml 或 10 ml 的无菌针筒内，进行腰椎穿刺后先使相当量的脑脊液流入针筒内，边抽边推，将全部药液于 3 ~ 5 分钟内缓缓注入。④肾功能减退患者的用量：按肾功能正常者每8小时1次，一次的正常剂量为 1 ~ 1.7 mg/kg，肌酐清除率为每分钟 10 ~ 50 ml 时，每12小时1次，一次为正常剂量的 30% ~ 70%；肌酐清除率每分钟 < 10 ml 时，每 24 ~ 48 小时给予正常剂量的 20% ~ 30%。⑤血液透析后可按感染严重程度，成人按体重一次补给剂量 1 ~ 1.7 mg/kg，小儿 (3个月以上) 一次补给 2 ~ 2.5 mg/kg。

【制剂与规格】硫酸庆大霉素注射液 (以庆大霉素计)：① 1 ml (2万U)；② 1 ml (4万U)；③ 2 ml (8万U)。

庆大霉素片 (以庆大霉素计)：① 20 mg (2万U)；② 40 mg (4万U)。

庆大霉素颗粒 (以庆大霉素计)：10 mg (1万U)。

妥布霉素 [保(乙)]

Tobramycin

【适应证】(1) 铜绿假单胞菌、变形杆菌属、大肠埃希菌、克雷伯菌属、肠杆菌属、沙雷菌属所致的新生儿脓毒症、败血症、中枢神经系统感染 (包括脑膜炎)、泌尿生殖系统感染、肺部感染、胆道感染、腹腔感染及腹膜炎、骨骼感染、烧伤、皮肤软组织感染、急性与慢性中耳炎、鼻窦炎等。(2) 与其他抗菌药物联合用于葡萄球菌感染 (耐甲氧西林菌株无效)。

【注意事项】(1) 肾功能不全、肝功能异常、前庭功能或听力减退者、失水、重症肌无力或帕金森病及老年患者

慎用。(2) 本品1个疗程不超过7～14日。(3) 交叉过敏：对一种氨基糖苷类抗生素如链霉素、庆大霉素过敏的患者，可能对本品过敏。(4) 对患者（尤其对肾功能减退者、早产儿、新生儿、婴幼儿或老年患者、休克、心力衰竭、腹水或严重失水等患者）应注意监测：①听电图，对老年患者须在用药前、用药过程中定期及长期用药后用以检测高频听力损害。②温度刺激试验，在用药前、用药过程中定期及长期用药后用以检测前庭毒性。③尿常规检查和肾功能测定，在用药前、用药过程上中定期测定肾功能，以防止严重肾毒性反应。④在用药过程中应注意监测本品的血清浓度，一般于静脉滴注后30分钟至1小时测血清峰浓度，于下次用药前测血清谷浓度，当峰浓度超过12μg/ml、谷浓度超过2μg/ml时易出现毒性反应。⑤肌酐清除率每分钟＜70ml者其维持剂量须根据测得的肌酐清除率进行调整。(5) 本品静脉滴注时必须经充分稀释。可将一次用量加入50～200ml 5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释成浓度为1mg/ml（0.1%）的溶液，在30～60分钟滴完（滴注时间不可少于20分钟），小儿用药时稀释的液量应相应减少。(6) 本品不能静脉注射，以免产生神经肌肉阻滞和呼吸抑制作用。不宜皮下注射，因可引起疼痛。(7) 对实验室检查指标的干扰：本品可使ALT、AST、血清胆红素浓度及血清乳酸脱氢酶浓度的测定值增高；血钙、镁、钾、钠浓度的测定值可能降低。孕妇禁用。(8) 妥布霉素亦可在人乳中少量分泌，故哺乳期妇女慎用或用药期间暂停哺乳。(9) 年龄对于妥布霉素的血药浓度有显著影响。剂量相同时，5岁以下小儿的平均血药峰浓度约为成人的1/2，5～10岁儿童约为成人的2/3。按体表面积计算给药剂量可消除年龄造成的差异。小儿应慎用。在小儿使用过程中，要注意监测听力和肾功能，以防产生肾毒性和耳毒性。(10) 老年患者应用后可产生各种毒性反应，因此在疗程中监测肾功能极为重要。肾功能正常者用药后亦可能产生听力减退。此外，老年患者应采用较小剂量或延长给药间隔，以与其年龄、肾功能和第Ⅷ对脑神经的功能相适应。

【禁忌证】(1) 对本品或其他氨基糖苷类过敏者、本人或家族中有人因使用链霉素引起耳聋或其他耳聋者禁用。(2) 肾衰竭者禁用。(3) 孕妇禁用。

【不良反应】发生率较多者有听力减退、耳鸣或耳部饱满感（耳毒性）、血尿、排尿次数显著减少或尿量减少、食欲减退、极度口渴（肾毒性）、步履不稳、眩晕（耳毒性、影响前庭、肾毒性）。发生率较低者有呼吸困难、嗜睡、极度软弱无力（神经肌肉阻滞或肾毒性）。本品引起肾功能减退的发生率较庆大霉素低。

【用法与用量】肌内注射或静脉滴注：①成人，按体重，一次1～1.7mg/kg，每8小时1次，疗程7～14日。②儿童，按体重，早产儿或出生0～7日小儿，一次2mg/kg，每12～24小时1次。其他小儿，一次2mg/kg，每8小时1次。

【制剂与规格】硫酸妥布霉素注射液（以妥布霉素计）：80mg（8万U）。

阿米卡星[基(基)，保(甲)]

Amikacin

【适应证】(1) 铜绿假单胞菌及部分其他假单胞菌、大肠埃希菌、变形杆菌属、克雷伯菌属、肠杆菌属、沙雷菌属、不动杆菌属等敏感革兰阴性杆菌与葡萄球菌属（甲氧西林敏感株）所致严重感染，如菌血症或败血症、细菌性心内膜炎、下呼吸道感染、骨关节感染、胆道感染、腹腔感染、复杂性尿路感染、皮肤软组织感染等。(2) 对卡那霉素、庆大霉素或妥布霉素耐药菌株所致的严重感染。

【禁忌证】对阿米卡星或其他氨基糖苷类过敏的患者禁用。

【注意事项】(1)～(7) 见链霉素注意事项的(1)～(7)。(8) 氨基糖苷类与β-内酰胺类（头孢菌素类与青霉素类）混合时可致相互失活，与上述抗生素联合应用时须分瓶滴注。阿米卡星亦不宜与其他药物同瓶滴注。

【不良反应】(1) 患者可发生听力减退、耳鸣或耳部饱满感；少数患者亦可发生眩晕、步履不稳等症状。听力减退一般于停药后症状不再加重，但个别在停药后

可能继续发展至耳聋。(2) 有一定肾毒性，患者可出现血尿，排尿次数减少或尿量减少、血尿素氮、血肌酐值增高等。大多系可逆性，停药后即见减轻，但亦有个别报道出现肾衰竭。(3) 软弱无力、嗜睡、呼吸困难等神经肌肉阻滞作用少见。(4) 其他不良反应有头痛、麻木、针刺感染、震颤、抽搐、关节痛、药物热、嗜酸性粒细胞增多、肝功能异常、视物模糊等。

【用法与用量】肌内注射或静脉滴注。(1) 成人：一日不超过 1.5 g，疗程不超过 10 日。①单纯性尿路感染对常用抗菌药耐药者，每 12 小时 0.2 g；②用于其他全身感染，每 12 小时 7.5 mg/kg，或每 24 小时 15 mg/kg。(2) 儿童：首剂 10 mg/kg，继以每 12 小时 7.5 mg/kg，或每 24 小时 15 mg/kg。(3) 肾功能减退患者：①肌酐清除率每分钟 > 50 ～ 90 ml 者每 12 小时给予正常剂量（7.5 mg/kg）的 60% ～ 90%；②肌酐清除率每分钟 10 ～ 50 ml 者每 24 ～ 48 小时用 7.5 mg/kg 的 20% ～ 30%。

【制剂与规格】硫酸阿米卡星注射液：① 1 ml：0.1 g (10 万 U)；② 2 ml：0.2 g (20 万 U)。

注射用阿米卡星：0.2 g。

奈替米星 [保（乙）]

Netilmicin

【适应证】(1) 敏感革兰阴性杆菌所致严重感染。如铜绿假单胞菌、变形杆菌属（吲哚阳性和阴性）、大肠埃希菌、克雷伯菌属、肠杆菌属、沙雷菌属及枸橼酸杆菌属等所致的新生儿脓毒症、败血症、中枢神经系统感染（包括脑膜炎）、尿路生殖系统感染、呼吸道感染、胃肠道感染、腹膜炎、胆道感染、皮肤或骨骼感染、中耳炎、鼻窦炎、软组织感染、李斯特菌病等。(2) 联合治疗葡萄球菌感染，但对耐甲氧西林葡萄球菌感染常无效。(3) 某些耐庆大霉素菌株所致严重感染。

【禁忌证】对奈替米星或任何一种氨基糖苷类抗生素过敏或有严重毒性反应者禁用。孕妇和新生儿禁用。

【注意事项】(1) 本品不适用于单纯性尿路感染的初治，败血症治疗中需联合应用具协同作用的药物。腹腔感染治疗，宜加用甲硝唑等抗厌氧菌药物。(2) 失水、第 8 对脑神经损害、重症肌无力或帕金森病及肾功能损害患者慎用。(3) 对一种氨基糖苷类抗生素如链霉素、庆大霉素过敏的患者，可能对奈替米星过敏。(4) 为避免或减少耳、肾毒性反应的发生，疗程一般不宜超过 14 日，治疗期间应定期监测尿常规、血尿素氮、血肌酐等，并密切观察前庭功能及听力改变。有条件者应进行血药浓度监测，调整剂量使血药峰浓度在 16 mg/L 以下，且不宜持续较长时间（如 2 ～ 3 小时以上），谷浓度避免超过 4 mg/L。(5) 不同情况的患者使用药物后血药浓度可能不同：如严重烧伤患者使用本品时血药浓度可能较低；剂量相同时，在发热患者的血药浓度较无发热者低，但退热后血药浓度可能升高。贫血患者本品的 $t_{1/2\beta}$ 也可能较短。(6) 对实验室检查指标的干扰：可使血糖、血碱性磷酸酶、AST 及 ALT 和嗜酸性粒细胞等的测定值升高，使白细胞、血小板等的测定值降低，多呈一过性。(7) 哺乳期妇女用药尚不明确，若使用本品宜暂停哺乳。(8) 新生儿应禁用。若确有应用指征，给药方案必须在血药浓度监测下进行调整。(9) 老年患者宜按轻度肾功能减退者减量用药。

【不良反应】(1) 肾毒性轻微并较少见。常发生于原有肾功能损害者，或应用剂量超过一般常用剂量的感染患者。(2) 神经系统毒性：可发生第Ⅷ对脑神经的毒性反应，但本品的毒性发生率较低，程度亦较轻，易发生在原有肾功能损害者，或治疗剂量过高、疗程过长的感染患者，表现为前庭及听力受损的症状，如出现头晕、眩晕、听觉异常等。(3) 其他：偶可出现头痛、全身不适、视觉障碍、心悸、皮疹、发热、呕吐及腹泻等。(4) 局部反应一般少见，偶有注射区疼痛。

【用法与用量】肌内注射或稀释后静脉滴注。静脉滴注时，取本品用 50 ～ 200 ml 氯化钠注射液、5% 葡萄糖注射液或其他灭菌稀释液稀释，于 1.5～2 小时静脉滴注；小儿的稀释液量应相应减少。于 1.5 ～ 2 小时缓慢滴注，应用本品宜定期监测血药浓度，使血药峰浓度

维持在6～10 mg/L，谷浓度为0.5～2 mg/L。成人，按体重每8小时1.3～2.2 mg/kg，或每12小时2～3.25 mg/kg。治疗复杂性尿路感染：按体重每12小时1.5～2 mg/kg。一日最高剂量不超过7.5 mg/kg。疗程均为7～14日。儿童，6周以内者，按体重每12小时2～3 mg/kg；6周至12岁者，按体重每8小时1.7～2.3 mg/kg，或按体重每12小时2.5～3.5 mg/kg。疗程均为7～14日。肾功能减退者，必须根据肾功能减退程度调整剂量或给药间隔时间；有条件时宜进行血药浓度监测，据其结果拟订个体化给药方案，使血药浓度调整至上述范围。

【制剂与规格】注射用硫酸奈替米星：①1 ml∶5万U；②2 ml∶10万U。

依替米星[保(乙)]

Etimicin

【适应证】用于敏感细菌所致的感染：呼吸道感染包括急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、社区肺部感染等，肾和泌尿生殖系统感染包括急性肾盂肾炎、膀胱性肾盂肾炎或慢性膀胱炎急性发作等，皮肤与软组织感染包括疖、痈、急性蜂窝组炎等，创伤、手术前后感染治疗或预防性用药。

【注意事项】(1) 肾功能受损者，不宜使用本品，必要时应调整剂量，并应监测血清中硫酸依替米星的浓度，并监测血肌酐及肌酐消除率。①改变给药次数：两次给药的间隔时间（小时）大致等于血清肌酐水平（mg/100 ml）乘以8；②改变治疗剂量：把常规推荐剂量除以血清肌酐水平。由于在感染过程中，肾功能随时可发生变化，因此硫酸依米星的使用剂量也应随时给予调整。(2) 在用本品治疗过程中应密切观察肾功能和第Ⅷ对脑神经功能的变化，并尽可能进行血药浓度检测。(3) 本品可能发生神经肌肉阻滞现象。

【禁忌证】对本品及其他氨基糖苷类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】不良反应为耳、肾的毒性，发生率和严重程度与奈替米星相似。别病例可见BUN、Cr、ALT及AST、ALP等肝、肾功能指标轻度升高，停药后即恢复正常。耳毒性和前庭毒性均较轻。主要发生于肾功能不全的患者，剂量过大或过量的患者，主要表现为眩晕、耳鸣等，个别患者电测听力下降，程度均较轻。

【用法与用量】静脉滴注：用于成人泌尿系统或全身性感染者，一次0.1～0.15 g，一日2次，稀释于氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液100 ml中，滴注1小时，疗程5～10日，或一日1次，200～300 mg溶于5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液100 ml中滴注1小时，疗程5～10日，病情严重或败血症者可适当延长疗程，必要时可与β-内酰胺类或其他抗生素联合应用。肾功能不良者，原则上不用，必要时应调整剂量，并监测血清依替米星的浓度。

【制剂与规格】注射用硫酸依替米星：①50 mg（5万U）；②100 mg（10万U）。

异帕米星[保(乙)]

Isepamicin

【适应证】用于对本品敏感细菌所致的外伤、烧伤、创面感染、肺炎、支气管炎、肾盂肾炎、膀胱炎、腹膜炎及败血症等。

【注意事项】(1) 肾功能不全、肝功能异常、前庭功能或听力减退者、失水、依靠静脉高营养维持生命的体质衰弱者、重症肌无力或帕金森病及老年患者慎用。(2) 对一种氨基糖苷类抗生素如链霉素、庆大霉素过敏的患者，可能对本品过敏。(3) 有条件时疗程中应监测血药浓度（本品血药峰浓度超过35 mg/L，谷浓度超过10 mg/L时易出现毒性反应），并据此调整剂量，不能测定血药浓度时，应根据测得的肌酐清除率调整剂量，尤其对肾功能减退者、早产儿、新生儿、婴幼儿或老年患者、休克、心力衰竭、腹水或严重失水等患者。(4) 本品静脉滴注时，滴速不能太快。静脉滴注液的配制方法：静脉滴注前须稀释本品，一般用氯化钠注射液、5%葡萄糖注射液、复方氯化钠注射液、复方氨基酸注射液、木糖醇注射液（5%）、复方乳酸钠注射液。(5) 本品不能静脉注射，以免产生神经肌肉阻滞和呼吸抑制作用。(6) 长期应用本品可致耐药菌过度生长。(7) 应给患者补充足够的水分，以减

少肾小管损害。(8) 本品亦可在乳汁中少量分泌，故哺乳期妇女慎用或用药期间暂停哺乳。(10) 若使用本品，应根据血药浓度或肌酐清除率调整剂量。(10) 老年患者慎用。老年患者应用本品后可产生各种毒性反应，因此在疗程中监测肾功能极为重要。肾功能正常者用药后亦可能产生听力减退。此外，老年患者应采用较小剂量或延长给药间隔，以与其年龄、肾功能和第Ⅷ对脑神经的功能相适应。老年患者有可能出现因维生素K缺乏而造成出血倾向。

【不良反应】(1) 常见听力减退、耳鸣或耳部饱满感（耳毒性）、血尿、排尿次数显著减少或尿量减少、食欲减退、极度口渴（肾毒性）、步履不稳、眩晕（耳毒性，影响前庭）、恶心或呕吐（耳毒性，影响前庭；肾毒性）。(2) 少见视力减退（视神经炎）、呼吸困难、嗜睡、极度软弱无力（神经肌肉阻滞）、皮疹等反应、血象变化、肝功能改变、消化道反应和注射部位疼痛、硬结等。(3) 罕见过敏性休克。

【禁忌证】(1) 对本品或其他氨基糖苷类及杆菌肽过敏者、本人或家族中有人因使用其他氨基糖苷类抗生素引起耳聋者禁用。(2) 肾衰竭者及妊娠期妇女禁用。(3) 早产儿、新生儿和婴幼儿禁用。

【用法与用量】肌内注射或静脉滴注：成人一日400 mg，分1～2次给药。静脉滴注，一日1次给药时，滴注时间不得少于1小时；一日2次，给药时，滴注时间宜控制为30～60分钟。肾功能不全患者应根据肾功能受损程度调整给药剂量和给药间隔。

【制剂与规格】硫酸异帕米星注射液：① 2 ml : 200 mg（20万U）；② 2 ml : 400 mg。

新霉素 [保(乙)]

Neomycin

【适应证】(1) 敏感菌所致的肠道感染。(2) 结肠手术前肠道准备或肝性脑病时作为辅助治疗。

【禁忌证】对新霉素或其他氨基糖苷类抗生素过敏的患者禁用本品。

【注意事项】(1) 交叉过敏，对一种氨基糖苷类抗生素如链霉素、庆大霉素、阿米卡星过敏的患者也可能对本品过敏。(2) 在用药过程中仍宜定期进行尿常规和肾功能测定，以防止出现肾毒性，并进行听力测定。(3) 下列情况应慎用，如失水、第Ⅷ对脑神经损害、重症肌无力、帕金森病、肾功能损害、溃疡性结肠炎及有口腔牙病患者（新霉素可引起口腔刺激或疼痛）。(4) 长期口服本品的慢性肠道感染患者尤其伴有肾功能减退或同服其他耳毒性或肾毒性药物者仍应注意出现肾毒性或耳毒性症状的可能。(5) 妊娠期妇女宜慎用。用药期间哺乳期妇女应暂停哺乳。(6) 缺乏早产儿及新生儿应用新霉素的安全性资料，不宜应用。(7) 老年患者慎用。

【不良反应】(1) 可引起食欲减退、恶心、腹泻等。(2) 较少发现听力缺乏、耳鸣或耳部饱满感；头晕或步态不稳；尿量或排尿次数显著减少或极度口渴。(3) 偶可引起肠黏膜萎缩而导致吸收不良综合征及脂肪性腹泻，甚至抗生素相关性肠炎。

【用法与用量】口服：(1) 成人，一次0.25～0.5 g，一日4次。肝性脑病的辅助治疗，一次0.5～1 g，每6小时1次，疗程5～6日。结肠手术前准备，每小时0.5 g，连用4次，继以每4小时0.5 g，共24小时。(2) 小儿一日25～50 mg/kg，分4次服用。

【制剂与规格】硫酸新霉素片（以新霉素计）：① 0.1 g（10万U）；② 0.25 g（25万U）。

9.3.5 四环素类

四环素类抗生素包括四环素、金霉素、土霉素及半合成四环素多西环素、美他环素和米诺环素。本类药物曾广泛用于临床，由于病原菌的耐药性增高及不良反应多见，目前本类药物仅适用于少数敏感细菌及衣原体属、立克次体等不典型病原体所致感染。

四环素 [保(甲/乙)]

Tetracycline

【适应证】(1) 立克次体病，包括流行性斑疹伤寒、地方性斑疹伤寒、落基山热、恙虫病和Q热。(2) 支原体属感染。

(3) 回归热。(4) 布氏杆菌病。(5) 霍乱。(6) 兔热病。(7) 鼠疫。治疗布氏杆菌病和鼠疫时需与氨基糖苷类联合应用。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应：对一种四环素类药物呈过敏者可对其他四环素类药物呈现过敏。(2) 长期用药期间应定期随访检查血常规及肾功能。(3) 患者和肾功能损害者不宜应用。如确有指征应用时须慎重考虑，并调整剂量。(4) 治疗性病时，如怀疑同时合并螺旋体感染，用药前须行暗视野显微镜检查及血清学检查，后者 1 个月 1 次，至少 4 次。(5) 由于较长时间静脉给药有发生血栓性静脉炎的可能，故应在病情许可时尽早改为口服给药。(6) 四环素可透过胎盘屏障进入胎儿体内，沉积在牙齿和骨的钙质区内，引起胎儿牙齿变色，牙釉质再生不良及抑制胎儿骨骼生长，该类药物在动物中有致畸胎作用。妊娠期间患者对四环素的肝毒性反应尤为敏感，因此妊娠期妇女应避免使用此类药物。如确有指征应用本品时一日滴注剂量以 1 g 为宜，不应超过 1 g，其血药浓度应保持在 15 mg/L 以下。(7) 四环素可自乳汁分泌，乳汁中浓度较高，对乳儿有潜在的发生严重不良反应的可能，哺乳期妇女应用时应暂停授乳。(8) 四环素可在任何骨组织中形成稳定的钙化合物，导致恒齿黄染、牙釉质发育不良和骨生长抑制，故 8 岁以下小儿不宜使用。(9) 老年患者常伴有肾功能减退，因此需调整剂量。应用本品，易引起肝毒性，故老年患者需慎用。

【禁忌证】有四环素类药物过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻等，偶可发生胰腺炎等，偶有食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即上床的患者。(2) 可致肝毒性，通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生肝毒性，但肝毒性亦可发生于并无上述情况的患者。本品偶可引起胰腺炎，四环素所致胰腺炎也可与肝毒性同时发生，患者并不伴有原发肝病。(3) 变态反应：多为斑丘疹和红斑，少数患者可出现荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮皮疹加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些使用四环素的患者日晒时会有光敏现象。所以，应建议患者不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑则立即停药。(4) 血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸性粒细胞减少。(5) 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视盘水肿等。(6) 肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症加重、高磷酸血症和酸中毒。(7) 二重感染：长期应用本品可诱发耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌和真菌等引起的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。(8) 四环素类的应用可使人体内正常菌群减少，导致维生素缺乏、真菌繁殖，出现口干、咽炎、口角炎、舌炎、舌苔色暗或变色等。(9) 四环素静脉应用时，局部可产生疼痛等刺激症状，严重者发生血栓性静脉炎。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：成人一日 1 ~ 1.5 g，分 2 ~ 3 次给药。滴注药液浓度约为 0.1%。8 岁以上小儿一日 10 ~ 20 mg/kg，分 2 次给药，一日剂量不超过 1 g。(2) 口服：成人，一次 0.25 ~ 0.5 g，每 6 小时 1 次。8 岁以上儿童，一日 25 ~ 50 mg/kg，分 4 次服用。疗程 7 ~ 14 日；支原体肺炎、布氏杆菌病则需 3 周。

【制剂与规格】盐酸四环素片：① 0.125 g；② 0.25 g。

盐酸四环素胶囊：0.25 g。

注射用盐酸四环素：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5 g。

土霉素 [保(甲)]

Oxytetracycline

【适应证】(1) 立克次体病：流行性斑疹伤寒、地方性斑疹伤寒、落基山热、恙虫病和 Q 热。(2) 支原体属感染。(3) 衣原体属感染，包括鹦鹉热、性病、淋巴肉芽肿、非特异性尿道炎、输卵管炎、宫颈炎及沙眼。(4) 回归热。(5) 布鲁菌病。(6) 霍乱。(7) 兔热病。(8) 鼠疫。(9) 软下疳。治疗布鲁菌病和鼠疫时需与氨基糖苷类联合应用。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应：对

一种四环素类药物呈现过敏者可对本品呈现过敏。(2) 长期用药应定期检查血常规以及肝、肾功能。(3) 口服本品时，应饮用足量（约 240 ml）水。(4) 本品宜空腹口服，即餐前 1 小时或餐后 2 小时服用。(5) 原有肝病及已有肾功能损害者慎用。(6) 治疗性病时，如怀疑同时合并梅毒螺旋体感染，用药前须行暗视野显微镜检查及血清学检查，后者 1 个月 1 次，至少 4 次。(7) 老年患者应用本品时应根据肾功能减退的程度调整剂量。

【禁忌证】有四环素类药物过敏史者禁用。本品可导致恒齿黄染，牙釉质发育不良和骨生长抑制，8 岁以下小儿禁用。本品可引起胎儿牙齿变色、牙釉质再生不良及抑制胎儿骨骼生长，妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 消化系统：胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻，偶有胰腺炎、食管炎和食管溃疡的报道。(2) 肝毒性：通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生肝毒性。(3) 变态反应：多为斑丘疹和红斑，此外可见荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些患者日晒时有光敏现象。(4) 血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸粒细胞减少。(5) 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高、头痛、呕吐、视盘水肿等。(6) 肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症加重、高磷酸血症和酸中毒。(7) 二重感染：长期应用本品可发生耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌和真菌等的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。(8) 本品可沉积在牙齿和骨骼中，致牙齿产生不同程度的变色黄染、牙釉质发育不良及龋齿，并可致骨骼发育不良。(9) 应用本品可使人体内正常菌群减少，导致维生素 B 缺乏，真菌繁殖，出现口干、咽痛、口角炎和舌炎等。

【用法与用量】口服：成人一日 1.5 ~ 2 g，分 3 ~ 4 次；8 岁以上儿童一日 30 ~ 40 mg/kg，分 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】土霉素片：0.25 g。

多西环素[保(甲)]

Doxycycline

【适应证】(1) 多西环素作为选用药物之一可用于下列疾病：①立克次体病，如流行性斑疹伤寒、地方性斑疹伤寒、落基山热、恙虫病和 Q 热。②支原体属感染。③衣原体属感染，包括鹦鹉热、性病、淋巴肉芽肿、非特异性尿道炎、输卵管炎、宫颈炎及沙眼。④回归热。⑤布氏杆菌病。⑥霍乱。⑦兔热病。⑧鼠疫。⑨软下疳。治疗布氏杆菌病和鼠疫时需与氨基糖苷类联合应用。(2) 对青霉素类过敏患者的破伤风、气性坏疽、雅司螺旋体、梅毒、淋病和钩端螺旋体病及放线菌属、李斯特菌感染。(3) 中、重度痤疮患者作为辅助治疗。

【注意事项】(1) 应用本品时可能发生耐药菌的过度繁殖。一旦发生二重感染，即停用本品并予以相应治疗。(2) 治疗性病时，如怀疑同时合并梅毒螺旋体感染，用药前须行暗视野显微镜检查及血清学检查，后者每月 1 次，至少 4 次。(3) 长期用药时应定期随访检查血常规及肝功能。(4) 肾功能减退患者可以应用，不必调整剂量，应用时通常亦不引起血尿素氮的升高。(5) 多西环素可与食品、牛奶或含碳酸盐饮料同服。(6) 多西环素可透过胎盘屏障进入胎儿体内，沉积在牙齿和骨的钙质区内，引起胎儿牙齿变色、牙釉质再生不良及抑制胎儿骨骼生长，该类药物在动物实验中有致畸胎作用，因此孕妇不宜应用。(7) 多西环素可自乳汁分泌，乳汁中浓度较高，哺乳期妇女应用时应暂停哺乳。(8) 8 岁以下儿童禁用。

【禁忌证】有四环素类药物过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 消化系统：本品口服可引起恶心、呕吐、腹痛、腹泻等胃肠道反应。偶有食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即卧床的患者。(2) 肝毒性：脂肪肝变性患者和妊娠期妇女容易发生，亦可发生于并无上述情况的患者。偶可发生胰腺炎，多西环素所致胰腺炎也可与肝毒性同时发生，患者并不伴有原发肝病。(3) 过敏反应：多为斑丘疹和红斑，

少数患者可有荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮皮损加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用多西环素的患者日晒可有光敏现象。所以，建议患者服用期间不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑应立即停药。(4) 血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸性粒细胞减少。(5) 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视盘水肿等，停药后可缓解。(6) 二重感染：长期应用可发生耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性菌和真菌等引起的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。(7) 四环素类的应用可使人体内正常菌群减少，并致维生素缺乏、真菌繁殖，出现口干、咽炎、口角炎和舌炎等。

【用法与用量】口服：①成人。抗菌及抗寄生虫感染，第一日 100 mg，每 12 小时 1 次，继以 100 ~ 200 mg，一日 1 次，或 50 ~ 100 mg，每 12 小时 1 次。淋病奈瑟菌性尿道炎和宫颈炎，一次 100 mg，每 12 小时 1 次，共 7 日。非淋病奈瑟菌性尿道炎，由沙眼衣原体或解脲脲原体引起者，以及沙眼衣原体所致的单纯性尿道炎、宫颈炎或直肠感染，均为一次 100 mg，一日 2 次，疗程至少 7 日。梅毒：一次 150 mg，每 12 小时 1 次，疗程至少 10 日。②儿童。8 岁以上者按体重 1 日 2.2 mg/kg，每 12 小时 1 次，继以 2.2 ~ 4.4 mg/kg，一日 1 次，或 2.2 mg/kg，每 12 小时 1 次。体重超过 45 kg 者用量同成人。

【制剂与规格】盐酸多西环素片：①0.05 g；②0.1 g。

盐酸多西环素胶囊：①0.25 g；②0.1 g。

米诺环素[保(乙)]

Minocycline

【适应证】用于对本品敏感的葡萄球菌、链球菌、肺炎球菌、淋病奈瑟菌、痢疾杆菌、大肠埃希菌、克雷伯菌、变形杆菌、铜绿假单胞菌、梅毒螺旋体及衣原体等引起的感染。①败血症、菌血症。②浅表性化脓性感染：毛囊炎、脓皮症、扁桃体炎、肩周炎、泪囊炎、牙龈炎、外阴炎、创伤感染、疖、疖肿症、痤疮、手术后感染等。③深部化脓性疾病：乳腺炎、淋巴管（结）炎、颌下腺炎、骨髓炎、骨炎。④急慢性支气管炎、喘息型支气管炎、支气管扩张、支气管肺炎、细菌性肺炎、异型肺炎、肺部化脓症。⑤痢疾、肠炎、感染性食物中毒、胆管炎、胆囊炎。⑥腹膜炎。⑦肾盂肾炎、肾盂膀胱炎、尿道炎、膀胱炎、前列腺炎、附睾炎、宫内感染、淋病、男性非淋菌性尿道炎。⑧中耳炎、鼻旁窦炎、颌下腺炎。⑨梅毒。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全、食管通过障碍者、老年人、口服吸收不良或不能进食者及全身状态恶化患者（因易引发维生素 K 缺乏症）慎用。(2) 由于具有前庭毒性，米诺环素已不作为脑膜炎奈瑟菌带菌者和脑膜炎奈瑟菌感染的治疗药物。(3) 对米诺环素过敏者有可能对其他四环素类也过敏。(4) 由于可致头晕、倦怠等，汽车驾驶员、从事危险性较大的机器操作及高空作业者应避免服用。(5) 米诺环素滞留于食管并崩解时，会引起食管溃疡，故应多饮水，尤其临睡前服用时。(6) 急性淋病奈瑟菌性尿道炎患者疑有初期或二期梅毒时，通常应进行暗视野检查，疑有其他类型梅毒时，每月应进行血清学检查，并至少进行 4 个月。(7) 严重肾功能不全患者的剂量应低于常用剂量，如需长期治疗，应监测血药浓度。(8) 用药期间应定期检查肝、肾功能。(9) 较易引起光敏性皮炎，故用药后应避免日晒。(10) 可与食品、牛奶或含碳酸盐饮料同服。(11) 可透过血-胎盘屏障进入胎儿体内，沉积在牙齿和骨的钙质区中，引起胎儿牙釉质发育不良，并抑制胎儿骨骼生长；在动物实验中有致畸胎作用。故孕妇和准备妊娠的妇女禁用。(12) 在乳汁中浓度较高，虽然可与乳汁中的钙形成不溶性络合物，吸收甚少，但由于本品可引起牙齿永久性变色，牙釉质发育不良，并抑制婴幼儿骨骼的发育生长，故哺乳期妇女用药期间应暂停哺乳。(13) 可引起牙齿永久性变色，牙釉质发育不良，并抑制骨骼的发育生长，8 岁以下小儿禁用。

【禁忌证】对本品及其他四环素类过敏者禁用。

【不良反应】(1) 菌群失调：米诺环素引起菌群失调较为多见。轻者引起维生素缺乏，也常可见到由于白色念珠菌和其他耐药菌所引起的二重感染。亦可发生难辨梭菌性抗生素相关性肠炎。(2) 消化道反应：食欲减退、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、口腔炎、舌炎、肛门周围炎等；偶可发生食管溃疡。(3) 肝损害：偶见恶心、呕吐、黄疸、脂肪肝、ALT 及 AST 升高、呕血和便血等，严重者可昏迷而死亡。(4) 肾损害：可加重肾功能不全者的肾损害，导致血尿素氮和肌酐值升高。(5) 影响牙齿和骨发育：本品可沉积于牙齿和骨中，造成牙齿黄染，并影响胎儿、新生儿和婴幼儿骨骼的正常发育。(6) 过敏反应：主要表现为皮疹、荨麻疹、药物热、光敏性皮炎和哮喘等。罕见全身性红斑狼疮，若出现，应立即停药并作适当处理。(7) 可见眩晕、耳鸣、共济失调伴恶心、呕吐等前庭功能紊乱（呈剂量依赖性，女性比男性多见），常发生于最初几次剂量时，一般停药 24～48 小时后可恢复。(8) 血液系统：偶有溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少、嗜酸性粒细胞增多等。(9) 维生素缺乏症：偶有维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原症、出血倾向等）、B 族维生素缺乏症状（如舌炎、口腔炎、食欲减退、神经炎）。(10) 颅内压升高：偶见呕吐、头痛、复视、视盘水肿、前囟膨隆等颅内压升高症状，应立即停药。(11) 休克：偶有休克现象发生，须注意观察，如发现有不适感、口内异常感、哮喘、便意、耳鸣等症状时，应立即停药，并作适当处理。(12) 皮肤：斑丘疹、红斑样皮疹等；偶见剥脱性皮炎、混合性药疹、多形性红斑和 Steven-Johnson 综合征。长期服用本品，偶有指甲、皮肤、黏膜处色素沉着现象发生。(13) 其他：偶有头晕、倦怠感等。长期服用本品，可使甲状腺变为棕黑色，甲状腺功能异常少见。罕见听力受损。

【用法和剂量】口服：成人首次 0.2 g，以后每 12 小时 0.1 g；或每 6 小时 50 mg。

【制剂与规格】盐酸米诺环素片：① 50 mg（5 万 U）；② 100 mg（10 万 U）。

盐酸米诺环素胶囊：① 50 mg（5 万 U）；② 100 mg（10 万 U）。

9.3.6 大环内酯类

目前临床应用的大环内酯类抗生素有红霉素、麦迪霉素、螺旋霉素、乙酰螺旋霉素、交沙霉素、吉他霉素等；新品种有阿奇霉素、克拉霉素、罗红霉素等，新品种对流感嗜血杆菌、肺炎支原体、肺炎衣原体等的抗微生物活性增强、口服后生物利用度提高、给药剂量减少、胃肠道及肝脏不良反应也较少，临床适应证有所扩大。

红霉素 [基(基)，保(甲)]

Erythromycin

【适应证】(1) 作为青霉素过敏患者治疗下列感染的替代用药：溶血性链球菌、肺炎链球菌等所致的急性扁桃体炎、急性咽炎、鼻窦炎；溶血性链球菌所致的猩红热、蜂窝织炎；白喉及白喉带菌者；气性坏疽、炭疽、破伤风；放线菌病；梅毒；李斯特菌病等。(2) 军团菌病。(3) 肺炎支原体肺炎。(4) 肺炎衣原体肺炎。(5) 其他衣原体属、支原体属所致泌尿生殖系统感染。(6) 沙眼衣原体结膜炎。(7) 淋球菌感染。(8) 厌氧菌所致口腔感染。(9) 空肠弯曲菌肠炎。(10) 百日咳。

【注意事项】(1) 溶血性链球菌感染用本品治疗时，至少需持续 10 日，以防止急性风湿热的发生。(2) 肾功能减退患者一般无需减少用量。(3) 用药期间定期随访肝功能。肝病患者和严重肾功能损害者红霉素的剂量应适当减少。(4) 患者对一种红霉素制剂过敏或不能耐受时，对其他红霉素制剂也可过敏或不能耐受。(5) 因不同细菌对红霉素的敏感性存在一定差异，故应做药敏测定。(6) 可通过胎盘屏障而进入胎儿循环，浓度一般不高，文献中也无对胎儿影响方面的报道，但孕妇应用时仍宜权衡利弊。(7) 红霉素有相当量进入母乳中，哺乳期妇女应用时应暂停哺乳。

【禁忌证】对红霉素类药物过敏者禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道反应多见，有腹泻、恶心、呕吐、中上腹痛、口舌疼痛、

胃纳减退等，其发生率与剂量大小有关。(2) 肝毒性少见，患者可有乏力、恶心、呕吐、腹痛、发热及肝功能异常，偶见黄疸等。(3) 大剂量（≥一日 4 g）应用时，尤其肝、肾疾病患者或老年患者，可能引起听力减退，主要与血药浓度过高(>12 mg/L）有关，停药后大多可恢复。(4) 过敏反应表现为药物热、皮疹、嗜酸性粒细胞增多等，发生率 0.5% ~ 1%。(5) 其他：偶有心律失常、口腔或阴道念珠菌感染。

【用法与用量】(1) 口服：①成人：一日 0.75 ~ 2 g，分 3 ~ 4 次；军团菌病，成人，一次 0.5 ~ 1.0 g，一日 4 次。预防风湿热复发，一次 0.25 g，一日 2 次。预防感染性心内膜炎，术前 1 小时口服 1 g，术后 6 小时再服用 0.5 g。②儿童：一日按体重 20 ~ 40 mg/kg，分 3 ~ 4 次。(2) 静脉滴注：①成人：一次 0.5 ~ 1.0 g，一日 2 ~ 3 次。军团菌病，一日 3 ~ 4 g，分 4 次。一日不超过 4 g。②儿童：一日按体重 20 ~ 30 mg/kg，分 2 ~ 3 次。③乳糖酸红霉素滴注液的配制：先加灭菌注射用水 10 ml 至 0.5 g 乳糖酸红霉素粉针瓶中或加 20 ml 至 1 g 乳糖酸红霉素粉针瓶中，用力振摇至溶解。然后加入氯化钠注射液或其他电解质溶液中稀释，缓慢静脉滴注，注意红霉素浓度为 1% ~ 5%。溶解后也可加入含葡萄糖的溶液稀释，但因葡萄糖溶液偏酸性，必须每 100 ml 溶液中加入 4% 碳酸氢钠注射液 1 ml。(3) 红霉素栓剂直肠给药：①成人：一次 0.1 g，一日 2 次，用送药器将药栓塞入肛门 2 cm 深处为宜。②儿童：按体重一日 20 ~ 30 mg/kg。

【制剂与规格】注射用乳糖酸红霉素：① 0.25 g（25 万 U）；② 0.3 g（30 万 U）。

硬脂酸红霉素片：① 0.05 g（5 万 U）；② 0.125 g（12.5 万 U）；③ 0.25 g（25 万 U）。

硬脂酸红霉素胶囊：① 0.1 g（10 万 U）；② 0.125 g（12.5 万 U）。

硬脂酸红霉素颗粒：50 mg（5 万 U）。

红霉素片：① 0.125 g（12.5 万 U）；② 0.25 g（25 万 U）。

红霉素栓：① 0.1 g；② 0.2 g。

红霉素软膏：1%。

红霉素眼膏：0.5%。

阿奇霉素 [基（基），保（甲/乙）]

Azithromycin

【适应证】(1) 化脓性链球菌引起的急性咽炎、急性扁桃体炎。(2) 敏感细菌引起的鼻窦炎、中耳炎、急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作。(3) 肺炎链球菌、流感嗜血杆菌及肺炎支原体所致的肺炎。(4) 沙眼衣原体及非多种耐药淋病奈瑟菌所致的尿道炎和宫颈炎。(5) 敏感细菌引起的皮肤软组织感染。

【注意事项】(1) 轻度肾功能不全患者（肌酐清除率每分钟 > 40 ml）不需作剂量调整，但阿奇霉素对较严重肾功能不全患者中的使用尚无资料，给这些患者使用阿奇霉素时应慎重。(2) 肝功能不全者慎用，严重肝病患者不应使用。用药期间定期随访肝功能。(3) 用药期间如果发生过敏反应（如血管神经性水肿、皮肤反应、Stevens-Johnson 综合征及中毒性表皮坏死松解症等），应立即停药，并采取适当措施。(4) 治疗期间，可能出现抗生素相关性肠炎。(5) 一次静脉滴注时间不得少于 60 分钟，滴注液浓度不得高于 2.0 mg/ml。(6) 治疗盆腔炎时若怀疑合并厌氧菌感染，应合用抗厌氧菌药物。(7) 进食可影响阿奇霉素的吸收，口服用药需在饭前 1 小时或餐后 2 小时服用。(8) 孕妇和哺乳期妇女慎用。(9) 治疗小于 6 个月小儿中耳炎、社区获得性肺炎及小于 2 岁小儿咽炎或扁桃体炎的疗效与安全性尚未确定。

【禁忌证】对阿奇霉素、红霉素或其他任何一种大环内酯类药物过敏者禁用。

【不良反应】(1) 常见：①胃肠道反应：腹泻、腹痛、稀便、恶心、呕吐等。②局部反应：注射部位疼痛、局部炎症等。③皮肤反应：皮疹、瘙痒。④其他反应：如畏食、头晕或呼吸困难等。(2) 也可引起下列反应：①消化系统：消化不良、胃肠胀气、黏膜炎、口腔念珠菌病、胃炎等。②神经系统：头痛、嗜睡等。③过敏反应：发热、皮疹、关节痛、支气管痉挛、过敏性休克和血管神经性水肿等。④其他反

应：味觉异常，实验室检查可见AST及ALT、肌酐、乳酸脱氢酶、胆红素及碱性磷酸酶升高，白细胞、中性粒细胞及血小板计数减少。

【用法与用量】(1) 口服：饭前1小时或餐后2小时服用。①成人用量：沙眼衣原体或敏感淋病奈瑟菌所致性传播疾病，仅需单次口服本品1.0 g；对其他感染的治疗：第1日，0.5 g顿服，第2～5日，一日0.25 g顿服，或一日0.5 g顿服，连服3日。②儿童：中耳炎、肺炎，第1日，10 mg/kg顿服（一日最大量不超过0.5 g），第2～5日，一日5 mg/kg顿服（一日最大量不超过0.25 g）；咽炎、扁桃体炎，一日12 mg/kg顿服（一日最大量不超过0.5 g），连用5日。(2) 静脉滴注。①成人社区获得性肺炎：一次0.5 g，一日1次，至少连续用药2日，继之换用口服制剂，一日0.5 g，7～10日为1个疗程。②盆腔炎：成人一次0.5 g，一日1次，用药1日或2日后，改用口服制剂，一日0.25 g，7日为1个疗程。(3) 静脉滴注的配制：将0.5 g用适量注射用水充分溶解，配制成0.1 g/ml后，再加入至250 ml或500 ml的氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液中，最终阿奇霉素浓度为1.0～2.0 mg/ml，然后静脉滴注。浓度为1.0 mg/ml者，滴注时间3小时；浓度为2.0 mg/ml者，滴注时间1小时。

【制剂与规格】注射用乳糖酸阿奇霉素（以阿奇霉素计）：① 0.125 g（12.5万U）；② 0.25 g（25万U）；③ 0.5 g（50万U）。

阿奇霉素注射液：① 2 ml：0.25 g；② 2 ml：0.125 g；③ 5 ml：0.5 g。

阿奇霉素葡萄糖注射液：① 100 ml，内含阿奇霉素0.2 g、葡萄糖5.0 g；② 100 ml，内含阿奇霉素0.125 g、葡萄糖5 g。

阿奇霉素糖浆：25 ml：0.5 g（50万U）。

阿奇霉素片：① 0.25 g（25万U）；② 0.5 g（50万U）。

阿奇霉素分散片：① 0.125 g（25万U）；② 0.25 g（50万U）。

阿奇霉素颗粒：① 0.125 g（12.5万U）；② 0.25 g（25万U）；③ 0.5 g（50万U）。

阿奇霉素胶囊：① 0.125 g（12.5万U）；② 0.25 g（25万U）。

阿奇霉素混悬剂：① 0.125 g（12.5万U）；② 0.25 g（25万U）。

阿奇霉素干混悬剂：2 g：0.1 g（10万U）。

地红霉素[保(乙)]

Dirithromycin

【适应证】用于12岁以上患者。对本品敏感菌引起的轻、中度感染：慢性支气管炎急性发作，社区获得性肺炎，鼻咽炎，扁桃体炎，单纯性皮肤和软组织感染。

【注意事项】(1) 轻度肝损伤者、肾功能不全者：不必调整剂量。(2) 可能产生假膜性结肠炎。轻度者停药即能奏效，对于中度至严重病例，就应采取适当的治疗措施。(3) 孕妇使用本品应权衡利弊。哺乳期妇女应慎用。

【禁忌证】对地红霉素、红霉素和其他大环内酯抗生素严重过敏的患者禁用。可疑或潜在菌血症患者禁用。

【不良反应】常见的有头痛、腹痛、腹泻、恶心、消化不良、眩晕/头晕、皮疹、呕吐等。

【用法与用量】本品可与食物同服或饭后1小时内服用，不得分割、压碎、咀嚼。一般情况下，一日1次，一次500 mg。慢性支气管炎急性发作及单纯性皮肤和软组织感染，疗程5～7日。急性支气管炎，疗程7日。社区获得性肺炎，疗程14日。咽炎和扁桃体炎，疗程10日。

【制剂与规格】地红霉素肠溶胶囊：250 mg。

琥乙红霉素[保(乙)]

Erythromycin Ethylsuccinate

【适应证】(1) 溶血性链球菌、肺炎链球菌等所致的急性扁桃体炎、急性咽炎、鼻窦炎；溶血性链球菌所致猩红热、蜂窝织炎；白喉及白喉带菌者；气性坏疽、炭疽、破伤风；放线菌病；梅毒；李斯特菌病等。(2) 军团菌病。(3) 肺炎支原体肺炎。(4) 肺炎衣原体肺炎。(5) 衣原体属、支原体属所致泌尿生殖系感染。(6) 沙

眼衣原体结膜炎。(7) 厌氧菌所致的口腔感染。(8) 空肠弯曲菌肠炎。(9) 百日咳。(10) 风湿热复发，感染性心内膜炎（风湿性心脏病、先天性心脏病、心脏瓣膜置换术后）及口腔，上呼吸道医疗操作时的预防用药（青霉素的替代用药）。

【注意事项】(1) 溶血性链球菌感染用本品治疗时，至少需持续 10 日，以防止急性风湿热的发生。(2) 对严重肾功能损害者应适当减少剂量。(3) 用药期间定期检查肝功能。(4) 患者对一种红霉素制剂过敏或不能耐受时，对其他红霉素制剂也可能过敏或不能耐受。

【禁忌证】对本品或其他红霉素制剂过敏者、慢性肝病患者、肝功能损害者及孕妇禁用。

【不良反应】(1) 服用本品后发生肝毒性反应者较服用其他红霉素制剂为多见，服药数日或 1 ~ 2 周后患者可出现乏力、恶心、呕吐、腹痛、皮疹、发热等。有时出现黄疸，停药后常可恢复。(2) 胃肠道反应有腹泻、恶心、呕吐、中上腹痛、口舌疼痛、胃纳减退等。(3) 大剂量（一日 ≥ 4 g）应用时，尤其肝、肾疾病患者或老年患者，可能引起听力减退，主要与血药浓度过高 (12 mg/L) 有关，停药后大多可恢复。(4)变态反应表现为药物热、皮疹、嗜酸性粒细胞增多等，发生率 0.5% ~ 1%。

【用法与用量】口服：成人，一日1.6 g，分 2 ~ 4 次服用。军团菌病患者，一次 0.4 ~ 1 g，一日 4 次。成人每日量一般不宜超过 4 g。预防链球菌感染，一次 400 mg，一日 2 次。衣原体或溶脲脲原体感染，一次 800 mg，每 8 小时 1 次，共 7 日；或一次 400 mg，每 6 小时 1 次，共 14 日。儿童，按体重一次 7.5 ~ 12.5 mg/kg，一日 4 次；或一次 15 ~ 25 mg/kg，一日 2 次；严重感染每日量可加倍，分 4 次服用。百日咳患儿，按体重一次 10 ~ 12.5 mg/kg，一日 4 次，疗程 14 日。

【制剂与规格】琥乙红霉素片：① 200 mg；② 400 mg。

罗红霉素[保(乙)]

Roxithromycin

【适应证】(1) 对本品敏感菌株引起的上呼吸道感染、下呼吸道感染、耳鼻喉感染、生殖器感染（淋球菌感染除外）、皮肤软组织感染。(2) 用于支原体肺炎、沙眼衣原体感染及军团病。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用。严重肝硬化者的半衰期延长至正常水平 2 倍以上，如确实需要使用，则一日 1 次，一次 150 mg。(2) 严重肾功能不全者给药时间延长 1 倍（一次 150 mg，一日 1 次）。(3) 本品与红霉素存在交叉耐药性。(4) 进食后服药会减少吸收，与牛奶同服可增加吸收。(5) 服用本品后可影响驾驶及机械操作能力。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见腹痛、腹泻、呕吐等胃肠道反应。偶见皮疹、头晕、头痛等。

【用法与用量】口服：成人一次0.15 g，一日 2 次，或遵医嘱，儿童一日按体重 5 ~ 10 mg/kg，分 2 次服用。

【制剂与规格】罗红霉素片：150 mg。

乙酰螺旋霉素[保(乙)]

Acetylspiramycin

【适应证】(1)对本品敏感的葡萄球菌、链球菌属和肺炎链球菌所致的轻、中度感染，如咽炎、扁桃体炎、鼻窦炎、中耳炎、牙周炎、急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、肺炎、非淋菌性尿道炎、皮肤软组织感染。(2) 隐孢子虫病或妊娠期妇女弓形体病。

【注意事项】(1) 严重肝功能不全患者慎用。(2) 严重肾功能不全患者慎用。(3) 如有变态反应，立即停药。(4) 孕妇应用时需充分权衡利弊，哺乳期妇女宜慎用。

【禁忌证】对本品、红霉素及其他大环内酯类过敏的患者禁用。

【不良反应】腹痛、恶心、呕吐等胃肠道反应，常发生于大剂量用药时，程度大多轻微，停药后可自行消失。变态反应极少，主要为药疹。

【用法与用量】口服：成人，一次 0.2~0.3 g，一日 4 次，首次加倍。儿童，一日

按体重 20 ~ 30 mg/kg，分 4 次服。

【制剂与规格】乙酰螺旋霉素片：0.1 g（10 万 U）。

克拉霉素[保（乙）]

Clarithromycin

【适应证】用于敏感菌所引起的感染：①鼻咽感染：扁桃体炎、咽炎、鼻窦炎。②下呼吸道感染：急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作和肺炎。③皮肤软组织感染：脓疱病、丹毒、毛囊炎、疖和伤口感染。④急性中耳炎、肺炎支原体肺炎、沙眼衣原体引起的尿道炎及宫颈炎等。⑤与其他药物联合用于鸟分枝杆菌感染、幽门螺杆菌感染的治疗。

【注意事项】(1) 肝功能损害、中度至严重肾功能损害者慎用。(2) 肾功能严重损害（肌酐清除率每分钟小于 30 ml）者，须作剂量调整：一次 0.25 g，一日 1 次；重症感染者首剂 0.5 g，以后一次 0.25 g，一日 2 次。(3) 与红霉素及其他大环内酯类药物之间有交叉过敏和交叉耐药性。(4) 可能出现真菌或耐药细菌导致的严重感染。(5) 可空腹口服，也可与食物或牛奶同服，与食物同服不影响其吸收。(6) 血液或腹膜透析不能降低克拉霉素的血药浓度。(7) 6 个月以下儿童的疗效和安全性尚未确定。

【禁忌证】(1) 对克拉霉素或大环内酯类药物过敏者禁用。(2) 孕妇、哺乳期妇女禁用。(3) 严重肝功能损害者、水电解质紊乱患者、服用特非那丁者禁用。(4) 某些心脏病（包括心律失常、心动过缓、QT 间期延长、缺血性心脏病、充血性心力衰竭等）患者禁用。

【不良反应】(1) 主要有口腔异味，腹痛、腹泻、恶心、呕吐等胃肠道反应，头痛，AST 及 ALT 短暂升高。(2) 可能发生过敏反应，轻者为药疹、荨麻疹，重者为过敏及 Stevens-Johnson 综合征。(3) 偶见肝毒性、艰难梭菌引起的抗生素相关性肠炎。(4) 可能发生短暂性中枢神经系统不良反应，包括焦虑、头晕、失眠、幻觉、噩梦或意识模糊。

【用法与用量】口服：①成人，一次 0.25 g，每 12 小时 1 次；重症感染者一次 0.5 g，每 12 小时 1 次。根据感染的严重程度应连续服用 6 ~ 14 日。②儿童，6 个月以上者按体重一次 7.5 mg/kg，每 12 小时 1 次。根据感染的严重程度应连续服用 5 ~ 10 日。

【制剂与规格】克拉霉素片：① 0.125 g（12.5 万 U）；② 0.25 g（25 万 U）。

克拉霉素胶囊：① 0.125 g（12.5 万 U）；② 0.25 g（25 万 U）。

克拉霉素分散片：① 50 mg；② 125 mg；③ 250 mg。

克拉霉素颗粒：2 g：0.125 g（12.5 万 U）

克拉霉素干混悬剂：① 1 g：0.125 g（12.5 万 U）；② 2 g：0.125 g（12.5 万 U）；③ 2 g：0.25 g（25 万 U）。

9.3.7 酰胺醇类

酰胺醇类抗生素包括氯霉素及甲砜霉素，但氯霉素可引起严重骨髓抑制、再生障碍性贫血及灰婴综合征等严重不良反应，使其在应用上受到很大限制，仅在某些中枢神经系统感染、伤寒、副伤寒、厌氧菌感染及立克次体感染时作为可选药物。

氯霉素[基（基）、保（甲）]

Chloramphenicol

【适应证】(1) 伤寒和副伤寒。严重沙门菌属感染合并败血症。(2) 耐氨苄西林的 B 型流感嗜血杆菌脑膜炎或对青霉素过敏患者的肺炎链球菌、脑膜炎奈瑟菌脑膜炎、敏感的革兰阴性杆菌脑膜炎。(3) 需氧菌和厌氧菌混合感染的脑脓肿（尤其耳源性）。(4) 严重厌氧菌（如脆弱拟杆菌）所致感染，累及中枢神经系统者，与氨基糖苷类抗生素合用治疗腹腔感染和盆腔感染，以控制同时存在的需氧和厌氧菌感染。(5) 无其他低毒性抗菌药可替代的敏感细菌（如由流感嗜血杆菌、沙门菌属及其他革兰阴性杆菌）所致的败血症及肺部感染，常与氨基糖苷类合用。(6) 立克次体感染：Q 热、落基山斑点热、地方性斑疹伤寒等。

【注意事项】(1) 可能发生不可逆性骨髓抑制，应避免重复疗程使用。(2) 肝、

肾功能损害患者宜避免使用，如必须使用时须减量应用，有条件时进行血药浓度监测，使其峰浓度在 25 mg/L 以下，谷浓度在 5 mg/L 以下。如血药浓度超过此范围，可增加引起骨髓抑制的危险。(3) 治疗过程中应定期检查周围血象，长程治疗者尚须查网织细胞计数，必要时做骨髓检查，以便及时发现与剂量有关的可逆性骨髓抑制，但全血象检查不能预测通常在治疗完成后发生的再生障碍性贫血。(4) 对诊断的干扰：采用硫酸铜法测定尿糖时，应用氯霉素患者可产生假阳性反应。(5) 口服时应饮用足量水分，空腹服用，即于餐前 1 小时或餐后 2 小时服用，以期达到有效血药浓度。(6) 新生儿不宜应用，有指征必须应用时，如有条件应在监测血药浓度条件下使用。(7) 老年患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。孕妇和哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 血液系统：①与剂量有关的可逆性骨髓抑制，常见于血药浓度超过25 mg/L的患者，临床表现为贫血，并可伴白细胞和血小板减少。②与剂量无关的骨髓毒性反应，常表现为严重的、不可逆性再生障碍性贫血，发生再生障碍性贫血者可有数周至数月的潜伏期，不易早期发现，其临床表现有血小板减少引起的出血倾向，如瘀点、瘀斑和鼻出血等，以及由粒细胞减少所致感染征象，如高热、咽痛、黄疸、苍白等。绝大多数再生障碍性贫血于口服氯霉素后发生。③溶血性贫血，可发生在某些先天性葡萄糖-6-磷酸脱氢酶不足的患者。④长程治疗可诱发出血倾向，可能与骨髓抑制、肠道菌群减少致维生素 K 合成受阻、凝血酶原时间延长等均有关。(2) 灰婴综合征，发生在出生后 48 小时内即投予高剂量的氯霉素，治疗持续 3 ~ 4 日后。临床表现为腹胀、呕吐、进行性苍白、发绀、微循环障碍，体温不升、呼吸不规则。类似表现亦可发生在成人或较大儿童应用更大剂量（按体重一日约 100 mg/kg）时。及早停药，尚可完全恢复。(3) 周围神经炎和视神经炎，常在长程治疗时发生，及早停药，常属可逆，也有发生视神经萎缩而致盲者。(4) 过敏反应较少见。可致各种皮疹、日光性皮炎、血管神经性水肿。一般较轻，停药后可迅速好转。(5) 二重感染，可致变形杆菌、铜绿假单胞菌、金黄色葡萄球菌、真菌等的肺、胃肠道及尿路感染。(6) 消化道反应，可有腹泻、恶心及呕吐等。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一日 1.5 ~ 3 g，分 3 ~ 4 次服用；②儿童，按体重一日 25 ~ 50 mg/kg，分 3 ~ 4 次服用；新生儿一日不超过 25 mg/kg，分 4 次服用。(2) 静脉滴注：注射用琥珀氯霉素临用前加灭菌注射用水使其溶解后再稀释成静脉滴注液。①成人，一日 2 ~ 3 g，分 2 次给予；②儿童，按体重一日 25 ~ 50 mg/kg，分 3 ~ 4 次给予；新生儿一日不超过 25 mg/kg，分 4 次给予。新生儿用药在条件许可时须监测血药浓度，根据结果调整给药方案，无监测条件者不宜应用。静脉注射给药时不宜过快。亦可肌内注射。

【制剂与规格】氯霉素片或胶囊：0.25 g。

棕榈氯霉素片：50 mg。

棕榈氯霉素颗粒：0.1 g。

棕榈氯霉素混悬液：1 ml ∶ 25 mg。

氯霉素注射液：① 1 ml ∶ 0.125 g；② 2 ml ∶ 0.25 g。

注射用琥珀氯霉素：① 0.125 g；② 0.25 g；③ 0.5 g。

氯霉素甘油滴耳液：2.5%。用于急、慢性中耳炎。 滴入耳道内，一次 2 ~ 3 滴 一日 3 次

9.3.8 林可霉素类

林可霉素类抗生素包括林可霉素及克林霉素，对需氧革兰阳性菌及厌氧菌具良好抗菌作用，克林霉素的体外抗菌活性优于林可霉素。

林可霉素 [保(甲/乙)]

Lincomycin

【适应证】(1) 敏感葡萄球菌属、链球菌属、肺炎链球菌及厌氧菌所致的：呼吸道感染、皮肤软组织感染、女性生殖道感染和盆腔感染及腹腔感染等。(2) 对青霉素过敏或不宜用青霉素的患者用作替代药物。

【注意事项】(1) 对林可霉素过敏时有可能对克林霉素类也过敏。(2) 对诊断的干扰：服药后 ALT 及 AST 可增高。(3) 肠道疾病或有既往史者（特别如溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关肠炎）、肝功能减退和肾功能严重减退者慎用、既往有哮喘或其他过敏史者慎用。(4) 用药期间需密切注意抗生素相关性肠炎的可能。(5) 为防止急性风湿热的发生，用本类药物治疗溶血性链球菌感染时的疗程，至少为 10 日。(6) 偶可导致二重感染。(7) 疗程长者，需定期检测肝、肾功能和血常规。(8) 孕妇应用时需充分权衡利弊。哺乳期妇女应慎用，如必须采用时应暂停哺乳。(9) 患有严重基础疾病的老年人易发生腹泻或抗生素相关性肠炎等不良反应，用药时需密切观察。

【禁忌证】对林可霉素和克林霉素有过敏史的患者禁用。

【不良反应】(1) 消化系统反应：恶心、呕吐、腹痛、腹泻等症状；严重者有腹绞痛、腹部压痛、严重腹泻（水样或脓血样），伴发热、异常口渴和疲乏（抗生素相关性肠炎）；偶可引起黄疸的报道。(2) 血液系统：偶可发生白细胞减少、中性粒细胞减低、中性粒细胞缺乏和血小板减少，再生障碍性贫血罕见。(3) 过敏反应：可见皮疹、瘙痒等，偶见荨麻疹、血管神经性水肿和血清病反应等，罕有表皮脱落、大疱性皮炎、多形性红斑和 Steven-Johnson 综合征的报道。(4) 静脉给药可引起血栓性静脉炎。快速滴注本品时可能发生低血压、心电图变化，甚至心搏、呼吸停止。

【用法与用量】(1) 口服：宜空腹服用。①成人：一日 1.5～2 g，分 3～4 次。②儿童：一日按体重 30～60 mg/kg，分 3～4 次口服，小于 4 周者不用。(2) 肌内注射：①成人：一日 0.6～1.2 g。②儿童：一日按体重 10～20 mg/kg，分次注射。小于 4 周者不用。(3) 静脉滴注：①成人一次 0.6 g，每 8 小时或 12 小时 1 次，每 0.6 g 溶于 100～200 ml 输液中，滴注 1～2 小时。②儿童：一日按体重 10～20 mg/kg。需注意静脉滴注时每 0.6 g 溶于不少于 100 ml 的溶液中，滴注时间不少于 1 小时。小于 4 周者不用。

【制剂与规格】盐酸林可霉素片：① 0.25 g；② 0.5 g。

盐酸林可霉素胶囊：① 0.25 g；② 0.5 g。

盐酸林可霉素注射液：① 2 ml : 0.6 g；② 1 ml : 0.2 g。

盐酸林可霉素口服溶液：① 10 ml : 0.5 g；② 100 ml : 5 g。

克林霉素 [基(基)、保(甲/乙)]

Clindamycin

【适应证】(1) 用于革兰阳性菌引起的感染。①扁桃体炎、化脓性中耳炎、鼻窦炎等。②急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、肺炎、肺脓肿和支气管扩张合并感染等。③皮肤和软组织感染：疖、痈、脓肿、蜂窝织炎、创伤、烧伤和手术后感染等。④泌尿系统感染：急性尿道炎、急性肾盂肾炎、前列腺炎等。⑤其他：骨髓炎、败血症、腹膜炎和口腔感染等。(2) 用于厌氧菌引起的感染。①脓胸、肺脓肿、厌氧菌性肺炎。②皮肤和软组织感染、败血症。③腹内感染：腹膜炎、腹腔内脓肿。④女性盆腔及生殖器感染：子宫内膜炎、非淋球菌性输卵管及卵巢脓肿、盆腔蜂窝织炎及妇科手术后感染等。

【注意事项】(1)～(9) 见林可霉素注意事项的 (1)～(9)。(10) 严重肾功能减退和（或）严重肝功能减退，伴严重代谢异常者，采用高剂量时需进行血药浓度监测。(11) 本品不能透过血-脑脊液屏障，故不能用于脑膜炎。(12) 不同细菌对本品的敏感性可有相当大的差异，故药敏试验有重要意义。

【禁忌证】本品与林可霉素、克林霉素有交叉耐药性，对克林霉素或林可霉素有过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道反应：常见恶心、呕吐、腹痛、腹泻等，严重者有腹绞痛、腹部压痛、严重腹泻（水样或脓血样），伴发热、异常口渴和疲乏（抗生素相关性肠炎）。腹泻、肠炎和抗生素相关性肠炎可发生在用药初期，也可发生在停药后数周。(2) 血液系统：偶可发生白细胞减少、中性粒细胞减少、嗜酸性粒细胞

增多和血小板减少等；罕见再生障碍性贫血。(3) 过敏反应：可见皮疹、瘙痒等，偶见荨麻疹、血管性水肿和血清病反应等，罕见剥脱性皮炎、大疱性皮炎、多形性红斑和Steven-Johnson综合征。(4)肝、肾功能异常，如一过性碱性磷酸酶、AST及ALT升高、黄疸等。(5) 静脉滴注可能引起静脉炎；肌内注射局部可能出现疼痛、硬结和无菌性脓肿。(6) 其他：耳鸣、眩晕、念珠菌感染等。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次0.15～0.3 g，一日4次，重症感染可增至一次0.45 g，一日4次。②儿童，4周或4周以上小儿，一日按体重8～16 mg/kg，分3～4次。4周以下者不用。

(2) 肌内注射或静脉滴注：①成人，一日0.6～1.2 g，分2～4次；严重感染，一日1.2～2.4 g，分2～4次静脉滴注。②儿童，4周及4周以上小儿，一日15～25 mg/kg，分3～4次应用；严重感染，一日25～40 mg/kg，分3～4次应用。小于4周者不用。③深部肌内注射，肌内注射的容量1次不能超过600 mg (8 ml：600 mg)，超过此容量应改为静脉给药。④静脉滴注时，每0.3 g需用50～100 ml氯化钠注射液或5%葡萄糖溶液稀释成小于6 mg/ml浓度的药液，滴注速度不宜过快，通常每分钟不超过20 mg。1小时内输入的药量不能超过1 200 mg。

【制剂与规格】盐酸克林霉素胶囊：① 0.075 g；② 0.15 g。

盐酸克林霉素棕榈酸酯颗粒剂（按克林霉素计）：① 1 g：37.5 mg；② 2 g：75 mg；③ 24 g：0.9 g。

盐酸克林霉素棕榈酸酯分散片：75 mg。

盐酸克林霉素注射液：① 4ml：0.3 g；② 8 ml：0.6 g；③ 2 ml：0.3 g。

注射用盐酸克林霉素：0.5 g。

克林霉素磷酸酯注射液：① 2 ml：0.3 g；② 4 ml：0.6 g。

注射用克林霉素磷酸酯：① 0.3 g；② 0.6 g；③ 1.2 g。

9.3.9 利福霉素类

利福霉素类抗生素有利福平、利福霉素、利福喷汀及利福布汀。利福平为抗结核治疗的一线药物和抗麻风联合疗法中的主要药物；利福平尚对甲氧西林耐药葡萄球菌、脑膜炎奈瑟菌、流感嗜血杆菌、嗜肺军团菌等细菌及沙眼衣原体、立克次体等非典型病原体具抗微生物活性。

利福喷汀为长效利福霉素类衍生物，抗菌活性强，半衰期长，一周用药1～2次，可替代利福平作为抗结核治疗联合用药之一。利福布汀为利福霉素的衍生物，其特点为对鸟分枝杆菌有效。

它们在抗结核病方面的应用，见9.4。

利福平 [基(基)，保(甲/乙)]

Rifampicin

【适应证】(1) 与其他抗结核药联合用于各种结核病的初治与复治（包括结核性脑膜炎）。(2)与其他药物联合用于麻风、非结核分枝杆菌感染。(3)与万古霉素（静脉）可联合用于甲氧西林耐药葡萄球菌所致的严重感染。利福平与红霉素联合方案用于军团菌属严重感染。(4) 无症状脑膜炎奈瑟菌带菌者，以消除鼻咽部脑膜炎奈瑟菌；(但不适用于脑膜炎奈瑟菌感染)。

【注意事项】(1) 酒精中毒、肝功能损害者慎用。婴儿、3个月以上孕妇和哺乳期妇女慎用。(2) 可致肝功能不全，在原有肝病患者或本品与其他肝毒性药物同服时有伴发黄疸死亡病例的报道，因此原有肝病患者，仅在有明确指征情况下方可慎用。(3) 高胆红素血症：系肝细胞性和胆汁潴留的混合型，轻症患者用药中自行消退，重者需停药观察。血胆红素升高也可能是利福平与胆红素竞争排泄的结果。治疗初期2～3个月应严密监测肝功能变化。(4) 单用利福平治疗结核病或其他细菌性感染时病原菌可迅速产生耐药性，故必须与其他药物合用。治疗可能需持续6个月至2年，甚至数年。(5) 可能引起白细胞和血小板减少，并导致齿龈出血和感染、伤口愈合延迟等。用药期间应避免拔牙等手术、并注意口腔卫生、刷牙及剔牙。用药期间应定期检查周围血象。(6) 应于餐前1小时或餐后2小时服用，最好清晨空腹一次服用，因进食影响吸收。(7) 肝功能

减退的患者常需减少剂量，一日剂量≤8 mg/kg。老年患者肝功能有所减退，用药量应酌减。(8) 肾功能减退者不需减量。在肾小球滤过率减低或无尿患者中利福平的血药浓度无显著改变。(9) 服药后便尿、唾液、汗液、痰液、泪液等排泄物均可显橘红色。有发生间质性肾炎的可能。(10) 可透过胎盘屏障，妊娠初始3个月内妇女禁用，3个月以上妇女慎用。(11) 哺乳期妇女用药应充分权衡利弊后决定是否用药。(12) 5岁以下小儿慎用。

【禁忌证】(1) 对利福平或利福霉素类抗菌药过敏者禁用。(2) 肝功能严重不全、胆道阻塞者和3个月以内孕妇禁用。

【不良反应】(1) 多见消化道反应：厌食、恶心、呕吐、上腹部不适、腹泻等胃肠道反应，但均能耐受。(2) 肝毒性为主要不良反应。在疗程最初数周内，少数患者可出现ALT及AST升高、肝大和黄疸，大多为无症状的ALT及AST一过性升高，在疗程中可自行恢复，老年人、酗酒者、营养不良、原有肝病或其他因素造成肝功能异常者较易发生。(3) 变态反应。大剂量间歇疗法后偶可出现“流感样症候群”，表现为畏寒、寒战、发热、不适、呼吸困难、头晕、嗜睡及肌肉疼痛等，发生频率与剂量大小及间歇时间有明显关系。偶可发生急性溶血或肾衰竭，目前认为其产生机制属过敏反应。(4) 其他。偶见白细胞减少、凝血酶原时间缩短、头痛、眩晕、视力障碍等。

【用法与用量】(1) 口服：①成人：抗结核治疗，一日0.45～0.6 g，空腹顿服，一日不超过1.2 g；脑膜炎奈瑟菌带菌者，5 mg/kg，每12小时1次，连续2日；②儿童：抗结核治疗，1个月以上者一日按体重10～20 mg/kg，空腹顿服，一日量不超过0.6 g。脑膜炎奈瑟菌带菌者，1个月以上者一日10 mg/kg，每12小时1次，连服4次。③老年患者：按一日10 mg/kg，空腹顿服。(2) 静脉滴注：以无菌操作法用5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液500 ml稀释本品后静脉滴注，建议滴注时间超过2～3小时。

【制剂与规格】利福平片：0.15 g。

利福平胶囊：① 0.15 g；② 0.3 g。

利福平注射液：5 ml：0.3 g。

注射用利福平：① 0.15 g；② 0.45 g；③ 0.6 g。

利福霉素[保(乙)]

Rifamycin

【适应证】用于结核杆菌感染的疾病和重症耐甲氧西林金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌以及难治性军团菌感染的联合治疗。

【注意事项】(1) 长期应用本品，可见ALT轻度增高，停药后一般可自行恢复。(2) 本品不宜与其他药物混合使用，以免药物析出。(3) 用药后患者尿液呈红色，属于正常现象。(4) 与异烟肼合用，对结核菌有协同抗菌作用，但对肝毒性亦增加。(5) 用药期间应监测肝功能。(6) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(7) 肝功能不全、胆道梗阻、慢性酒精中毒者应用本品应适当减量。

【禁忌证】(1) 有肝病或肝损害者禁用。(2) 对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 滴注过快时可出现暂时性巩膜或皮肤黄染。(2) 少数患者可出现一过性肝脏损害、黄疸及肾损害。(3) 其他不良反应有恶心、食欲缺乏及眩晕，偶见耳鸣及听力下降、过敏性皮炎等。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：①成人，一般感染一次0.5 g，配于5%葡萄糖注射液250 ml中，一日2次；中重度感染：一次1 g，配于5%葡萄糖注射液500 ml中，一日2次。滴速不宜过快。②小儿：用量为一日按体重10～30 mg/kg，一日2次或遵医嘱。(2) 静脉注射：成人，一次0.5 g，一日2～3次，缓慢注射。

【制剂与规格】利福霉素钠注射液：5 ml：0.25 g(25万U)(以利福霉素计)。

利福昔明[保(乙)]

Rifaximin

【适应证】对本品敏感的病原菌引起的肠道感染，包括急性和慢性肠道感染、腹泻综合征、夏季腹泻、旅行者腹泻和小肠结肠炎等。

【注意事项】(1) 儿童连续服用本药不能超过7日。(2) 6岁以下儿童不要服

用本药片剂。(3) 长期大剂量用药或肠黏膜受损时,会有极少量(少于1%)被吸收,导致尿液呈粉红色。(4) 如果出现对抗生素不敏感的微生物,应中断治疗并采取其他适当治疗措施。(5) 妊娠期妇女需权衡利弊后用药。(6) 哺乳期妇女可在有适当医疗监测的情况下服用本药。

【不良反应】常见恶心、呕吐、腹胀、腹痛;少见荨麻疹、足部水肿。肝性脑病患者服用本品后,可有体重下降、血清钾和血清钠浓度轻度升高。

【禁忌证】对本药或利福霉素类药过敏者、肠梗阻者、严重的肠道溃疡性病变患者。

【用法与用量】口服:成人,一次0.2 g,一日4次。儿童,6~12岁,一次0.1~0.2 g,一日4次;12岁以上儿童,剂量同成人,1个疗程不应超过7日。

【制剂与规格】利福昔明胶囊:0.1 g。

9.3.10 糖肽类及多肽类

万古霉素、去甲万古霉素和替考拉宁分子中均含有糖及肽链结构,属糖肽类抗生素;多黏菌素类中的某些品种和杆菌肽的分子中也含有多肽结构,属多肽类抗生素;两者又统称为多肽类抗生素。多肽类抗生素具有以下相同之处:抗菌谱窄,抗菌作用强,属杀菌药,并具有不同程度的肾毒性,主要适用于对其敏感的多重耐药菌所致的重症感染。

万古霉素[保(乙)]

Vancomycin

【适应证】(1) 对甲氧西林耐药的葡萄球菌引起的感染。(2) 对青霉素过敏的患者及不能使用其他抗生素包括青霉素、头孢菌素类,或使用后治疗无效的葡萄球菌、肠球菌和棒状杆菌、类白喉杆菌属等感染(如心内膜炎、骨髓炎、败血症或软组织感染等)。(3) 防治血液透析患者发生的葡萄球菌属所致的动、静脉血分流感染。(4) 长期服用广谱抗生素所致难辨梭状杆菌引起的抗生素相关性肠炎或葡萄球菌性肠炎。

【注意事项】(1) 快速给药(在数分钟内)可能伴发严重低血压包括休克,罕有心搏停止现象。应以稀释溶液静脉滴注,滴注时间至少在60分钟以上。(2) 用药过量的患者,或肾功能不全的患者、或原本有失聪现象或正同时接受其他耳毒性药物的患者,宜连续进行肾功能测定和听力功能试验,以及早发现肾毒性或耳毒性的发生。(3) 有可能引发抗生素相关性肠炎。(4) 口服多剂量本品,治疗由艰难梭状芽胞杆菌引起的抗生素相关性肠炎时,有些患者的血清浓度会升高。(5) 给予万古霉素,有发生可逆性嗜中性粒细胞减少症的报告,如果患者进行万古霉素长期疗法或是并用药物会产生嗜中性粒细胞减少症时,应定期监测粒细胞数。(6) 与静脉滴注有关的不良反应(包括低血压、脸红、红斑、荨麻疹及瘙痒)发作频率,可因合并用麻醉药而增加,使用麻醉药前60分钟滴注,可使这些不良反应减至最少。(7) 不宜肌内注射,静脉滴注时尽量避免药液外漏,且应经常更换注射部位,滴速不宜过快。(8) 在治疗过程中应监测血药浓度,尤其是需延长疗程者或有肾功能、听力减退者和耳聋病史者。血药浓度峰值不应超过20~40 μg/ml,谷浓度不应超过10 μg/ml。血药浓度高于60 μg/ml为中毒浓度。(9) 治疗葡萄球菌性心内膜炎,疗程应不少于4周。(10) 未成熟的新生儿及婴幼儿,最好确定所需的万古霉素血清浓度。并用万古霉素及麻醉药于儿童,会引起红斑及类似组胺反应的面红。

【禁忌证】对万古霉素过敏者,严重肝、肾功能不全者,孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 休克、过敏样症状(少于0.1%)(呼吸困难、全身潮红、水肿等)。(2) 急性肾功能不全(0.5%),间质性肾炎(频率不明)。(3) 多种血细胞减少(少于0.1%)、无粒细胞血症、血小板减少。(4)皮肤黏膜综合征(Stevens-Johnson综合征)、中毒性表皮坏死松解症(Lyell综合征)、脱落性皮炎(频率不明)。(5) 第Ⅷ对脑神经损伤(少于0.1%)。(6) 假膜性大肠炎(频率不明)。(7) 肝功能损害、黄疸(频率不明)。

【用法与用量】(1) 口服:用于治疗由难辨梭状杆菌引起的与使用抗生素有关

的抗生素相关性肠炎。①成人：一日总剂量为0.5～2g，分3～4次服，一日量不超过4g，连服7~10日。②儿童：一日总剂量按体重40 mg/kg，分3～4次服用，连服7～10日。一日量不超过2g。(2) 静脉滴注：成人用的药物浓度5 mg/ml；给药速度不高于10 mg/min；对需要限制液体的患者，最高不超过10 mg/ml的浓度。①成人（肾功能正常）：一日2g，每6小时0.5g或每12小时1g。老年人每12小时500 mg或每24小时1g。滴注时间在60分钟以上。②儿童：一次总量10 mg/kg，每6小时滴注1次，一次给药时间至少为60分钟以上；新生儿及婴儿，初用剂量按体重15 mg/kg，以后10 mg/kg，出生1周的初生儿，每12小时给药一次，而出生1周至1个月者，则每8小时一次，一次给药时间至少60分钟以上。应密切监测其万古霉素的血清浓度。③肾功能不全及老年患者：万古霉素一日剂量以毫克为单位，约为肾小球过滤率的15倍。肾功能有轻度至中度不全的患者，其初次剂量亦应不少于每15 mg/kg。以便立即达到治疗血清浓度。维持剂量24小时，1.9 mg/kg。对于严重肾功能不全患者，由于给予0.25～1g单一剂量较为方便，可能数日才给药一次。无尿患者，7～10日给予1g。(3) 配药方法：将一次量的药物先用10 ml灭菌注射用水溶解，再用100 ml或100 ml以上的氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液稀释，滴注时间在60分钟以上。如采取连续滴注给药，则可将一日量药物加到24小时内所用的输液中给予。

【制剂与规格】注射用盐酸万古霉素：①0.5g（50万U)；②1.0g（100万U)。

盐酸万古霉素胶囊：①0.125g（12.5万U)；②0.25g（25万U)。

去甲万古霉素[保(乙)]

Norvancomycin

【适应证】(1) 耐甲氧苯青霉素的金黄色葡萄球菌（MRSA）所致的系统感染和难辨梭状芽胞杆菌所致的肠道感染和系统感染。(2) 青霉素过敏者不能应用青霉素类或头孢菌素类、或经上述抗生素治疗无效的严重葡萄球菌感染。(3) 对青霉素过敏患者的肠球菌心内膜炎、棒状杆菌属（类白喉杆菌属）的心内膜炎。(4) 对青霉素过敏与青霉素不过敏的血液透析患者发生葡萄球菌属所致动、静脉分流感染。

【注意事项】(1) 不可肌内注射或静脉注射。(2) 静脉滴注速度不宜过快，一次剂量（0.4～0.8g）应至少用200 ml 5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液溶解后缓慢滴注，滴注时间宜在1小时以上。(3) 肾功能不全患者慎用，如有应用指征时需在治疗药物浓度监测下，根据肾功能减退程度减量应用。(4) 对诊断的干扰：血尿素氮可能增高。(5) 治疗期间应定期检查听力、尿液中蛋白、管型、细胞数及测定尿相对密度等。(6) 妊娠期患者避免应用。哺乳期妇女慎用。(7) 新生儿和婴幼儿中尚缺乏应用的资料。(8) 用于老年患者有引起耳毒性与肾毒性的危险（听力减退或丧失）。老年患者即使肾功能测定在正常范围内，使用时应采用较小治疗剂量。

【禁忌证】对万古霉素类抗生素过敏者。

【不良反应】(1) 可出现皮疹、恶心、静脉炎等。(2) 可引致耳鸣、听力减退，肾功能损害。(3) 个别患者尚可发生一过性周围血象白细胞降低、ALT及AST升高等。(4) 快速注射可出现类过敏反应血压降低，甚至心搏停止，以及喘鸣、呼吸困难、皮疹、上部躯体发红（红颈综合征）、胸背部肌肉痉挛等。

【用法与用量】静脉缓慢滴注：临用前加适量注射用水溶解。再用250 ml以上的氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液稀释，滴注时间在60分钟以上。如采取连续滴注给药，则可将一日量药物加到24小时内所用的输液中给予。①成人。一日0.8～1.6g（80万～160万U)，分2～3次静脉滴注。②儿童。小儿一日按体重16～24 mg/kg（1.6万～2.4万U/kg)，分2次静脉滴注。

【制剂与规格】注射用盐酸去甲万古霉素：①0.4g（40万U)；②0.8g（80万U)。

替考拉宁[保（乙）]

Teicoplanin

【适应证】(1) 各种严重的革兰阳性菌感染，包括不能用青霉素类及头孢素类抗生素治疗或上述抗生素治疗失败的严重葡萄球菌感染，或对其他抗生素耐药的葡萄球菌感染。(2) 敏感菌金黄色葡萄球菌、凝固酶阴性葡萄球菌（包括对甲氧西林敏感及耐药菌）、链球菌、肠球菌、单核细胞增多性李斯特菌、棒状杆菌、艰难梭菌、消化链球菌等所致的感染，包括：下呼吸道感染、泌尿道感染、败血症、心内膜炎、腹膜炎、骨关节感染、皮肤软组织感染。(3) 作为万古霉素和甲硝唑的替代药。

【注意事项】(1) 替考拉宁与万古霉素可能有交叉过敏反应，故对万古霉素过敏者慎用。但用万古霉素曾发生“红人综合征”者非本品禁忌证。(2) 治疗期间定期做血液、肝、肾功能的检查。(3) 有下列情况者应对肾、耳功能进行监测：①肾功能不全者长时间用药。②使用神经毒或肾毒性药物（如：氨基糖苷类抗生素、多黏菌素 E、两性霉素 B、环孢素、顺铂、呋塞米和依他尼酸），之后或与这两类药物联合应用。③液体待其泡消，再抽出液体。④再稀释后静滴。配制好的溶液应立即使用，未用完部分应丢弃。如少数情况下配制好后不能立即使用，则将其配制好的注射用替考拉宁溶液在4℃条件下保存，但不得超过 24 小时。(4) 肾功能受损者应调整剂量。(5) 妊娠期间以及哺乳期间一般不应用。(6) 可用于 2 个月以上儿童的革兰阳性菌感染。(7) 除非有肾损害，否则老年患者无需调整剂量。

【禁忌证】有替考拉宁过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 局部反应：注射部位疼痛、血栓性静脉炎。(2) 过敏反应：皮疹、瘙痒、支气管痉挛、药物热、过敏反应。(3) 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹泻。(4) 神经系统反应：嗜睡、头痛。(5) 血常规异常：嗜酸性粒细胞增多、白细胞减少、中性粒细胞减少、血小板减少、血小板增多。(6) 肝肾功能异常：AST、ALT 及碱性磷酸酶增高，一过性血肌酐增高。(7) 其他：轻微听力下降、耳鸣及前庭功能紊乱。

【用法与用量】肌内或静脉注射、静脉滴注：(1) 药物配制：用 3 ml 注射用水缓慢注入含替考拉宁瓶内，轻轻转动小瓶，直至粉末完全溶解，避免产生泡沫。如有泡沫形成，可放置 15 分钟，待泡沫消失，将液体完全吸入注射器中，配置好的溶液可加入下列注射液中使用：氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液或 5% 葡萄糖与 0.9% 氯化钠复方注射液或腹膜透析液中。配置好的溶液应立即使用，如少数情况下不能立即使用时可在4℃条件下保存，但不得超过 24 小时。(2) 用量：①成人和老年人：中度，下呼吸道感染、泌尿道感染、皮肤软组织感染，静脉给药首剂 0.4 g，以后维持剂量 0.2 g，一日 1 次。重度骨关节感染、败血症、心内膜炎、腹膜炎等，静脉给药首剂，每 12 小时静脉给药 0.4 g，连续 3 次，以后维持剂量 0.4 g，一日 1 次。口服给药用于艰难梭状芽胞杆菌性抗生素相关性肠炎，剂量为一次 100 ~ 500 mg，一日 2 ~ 4 次，疗程 10 日。②儿童：严重感染和中性粒细胞减少者，10 mg/kg，前 3 剂负荷剂量每 12 小时静脉注射 1 次，随后剂量为 10 mg/kg，静脉或肌内注射，一日 1 次。中度感染，前 3 剂负荷剂量一次 10 mg/kg，每 12 小时静脉注射 1 次；随后维持剂量 6 mg/kg，静脉或肌内注射，一日 1 次。小于 2 个月者：第 1 天的负荷剂量 16 mg/kg，只用 1 剂，随后 8 mg/kg，一日 1 次。静脉滴注时间不少于 30 分钟。③肾功能不全和老年患者：前 3 日仍然按常规剂量，第 4 日开始减少剂量。肌酐清除率每分钟 40 ~ 60 ml 者，剂量减半，方法是按常规，隔日 1 次；或剂量减半，一日 1 次。肌酐清除率每分钟少于 40 ml 或血液透析者，剂量为常规剂量的 1/3。或可按常规剂量给药，每 3 日 1 次，或按常规剂量 1/3 给药，一日 1 次。本品不能被血透清除。④持续不卧床腹膜透析者：首剂 0.4 g，静脉给药，随后第 1 ~ 2 周按每升透析液 20 mg 的剂量给药，第 3 周按 3 L 透析液 20 mg 的剂量给药。

【制剂与规格】注射用替考拉宁：0.2 g。

黏菌素

Colistin

【适应证】用于肠道手术前准备，用于大肠埃希菌性肠炎和对其他药物耐药的菌痢。

【注意事项】(1) 严重肾功能损害者慎用。(2) 不宜与其他肾毒性药物合用。(3) 孕妇慎用。

【禁忌证】对黏菌素过敏者禁用。

【不良反应】食欲减退、恶心和呕吐等胃肠道反应及皮疹、瘙痒等过敏反应。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一日100万～300万U，分3次服。②儿童，一次25万～50万U，一日3～4次。宜空腹给药。(2) 肌内注射或静脉滴注：成人，一日100万～150万U，儿童，一日2万～3万U/kg，分2～4次肌内注射或静脉滴注。

【制剂与规格】注射用硫酸黏菌素（抗毒素）：50 mg。

硫酸黏菌素片：① 50万U；② 100万U；③ 300万U。

硫酸黏菌素颗粒剂：1 g : 100万U。

9.3.11 硝基呋喃类药

硝基呋喃类药属广谱抗菌药物，细菌对之不易产生耐药性，口服吸收差，血药浓度低。本类药物包括呋喃妥因、呋喃唑酮、呋喃西林，呋喃妥因主要用于敏感菌所致的急性单纯性膀胱炎的治疗以及反复发作性尿路感染的预防，呋喃唑酮主要治疗肠道感染，贾第鞭毛虫、阴道滴虫病的治疗。呋喃西林目前仅作外用。

呋喃妥因[基(基)，保(甲)]

Nitrofurantoin

【适应证】(1) 敏感的大肠埃希菌、肠球菌属、葡萄球菌属以及克雷伯菌属、肠杆菌属等细菌所致的急性单纯性下尿路感染。(2) 预防尿路感染。

【注意事项】(1) 宜与食物同服，以减少对胃肠道的刺激。(2) 疗程至少7日，或继续用药至尿液中细菌清除3日以上。(3) 长期应用6个月以上者，可能发生弥漫性间质性肺炎或肺纤维化。因此将长期预防应用需权衡利弊。(4) 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏症、周围神经病变、肺部疾病患者慎用。(5) 老年患者应慎用，并宜根据肾功能调整给药剂量。

【禁忌证】新生儿、孕妇、哺乳期间妇女、肾功能减退及对硝基呋喃类药过敏者。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、食欲减退和腹泻。(2) 少见皮疹、药物热、粒细胞减少、肝炎等变态反应，有葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者尚可发生溶血性贫血。(3) 偶见头痛、头晕、嗜睡、肌痛、眼球震颤等神经系统不良反应，多属可逆，严重者可发生周围神经炎，原有肾功能减退或长期服用本品的患者易于发生；另外，偶见发热、咳嗽、胸痛、肺部浸润和嗜酸性粒细胞增多等急性肺炎表现，停药后可迅速消失，重症患者采用皮质激素可能减轻症状；长期服用6个月以上的患者，偶可引起间质性肺炎或肺纤维化，应及早停药并采取相应治疗措施。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次50～100 mg，一日3～4次。单纯性下尿路感染用低剂量。预防尿路感染反复发作，一日50～100 mg，睡前服。儿童按体重，1个月以上小儿一日5～7 mg/kg，分4次服。疗程至少1周，或用至尿培养转阴后至少3日。预防尿路感染反复发作，一日1 mg/kg。(2) 直肠给药：①成人，一次100 mg，一日1～2次。预防尿路感染反复发作，一日100～200 mg。②儿童，一次50 mg，一日1～2次。疗程至少1周，或用至尿培养转阴后至少3日。预防尿路感染反复发作，一日50～100 mg。

【制剂与规格】呋喃妥因片：50 mg。

呋喃妥因肠溶胶囊：50 mg。

呋喃妥因栓：① 50 mg；② 100 mg。

呋喃唑酮[保(甲)]

Furazolidone

【适应证】用于敏感菌所致的细菌性痢疾，肠炎、霍乱、伤寒、副伤寒、贾第鞭毛虫病、滴虫病等。与抗酸药等合用治疗幽门螺杆菌所致的消化性溃疡、胃窦炎。

【注意事项】(1) 不宜用于溃疡病或支气管哮喘患者。(2) 用药期间饮酒，可

引起双硫仑样反应，表现为皮肤潮红、瘙痒、发热、头痛、恶心、腹痛、心动过速、血压升高、胸闷、烦躁等，故服药期间和停药后5日内禁止饮酒。(3) 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G-6-PD）缺乏者可致溶血性贫血。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。新生儿禁用。孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】主要有恶心，呕吐、腹泻、头痛、头晕、药物热、皮疹、肛门瘙痒、哮喘、直立性低血压、低血糖、肺浸润等，偶可出现溶血性贫血、黄疸及多发性神经炎。

【用法与用量】口服：肠道感染疗程为5～7日，贾第鞭毛虫病疗程为7～10日。①成人，一次0.1g，一日3～4次。②儿童，按体重一日5～10 mg/kg，分4次服。

【制剂与规格】呋喃唑酮片：① 10 mg；② 30 mg；③ 100 mg。

9.3.12 硝基咪唑类

本类药有甲硝唑与替硝唑同属硝基咪唑类衍生物，对滴虫，阿米巴和兰氏贾第鞭毛虫等原虫，及脆弱拟杆菌等厌氧菌具强大抗菌活性。为治疗肠道和肠外阿米巴病、阴道滴虫病的首选药物；亦广泛用于各种厌氧菌感染；口服也可用于艰难梭菌所致的假膜性肠炎、与其他药物联合用于幽门螺杆菌所致的胃窦炎及消化性溃疡。与其他抗菌药物联合使用也可作为盆腔、肠道、腹腔手术的预防用药。

甲硝唑 [基(基). 保(甲/乙)]

Metronidazole

【适应证】(1) 肠道和肠外阿米巴病（如阿米巴肝脓肿、胸膜阿米巴病等）；(2) 阴道滴虫病、小袋虫病和皮肤利什曼病、麦地那龙线虫感染等；(3) 厌氧菌感染。

【注意事项】(1) 本品的代谢产物可使尿液呈深红色。(2) 原有肝脏疾患者剂量应减少。出现运动失调或其他中枢神经系统症状时应停药。重复一个疗程之前，应做白细胞计数。厌氧菌感染合并肾衰竭者，给药间隔时间应由8小时延长至12小时。(3) 用药期间应戒酒，饮酒后可能出现腹痛、呕吐、头痛等症状。

【禁忌证】有活动性中枢神经系统疾病、血液病者、孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 消化系统：恶心、呕吐、食欲缺乏、腹部绞痛，一般不影响治疗。(2) 神经系统：头痛、眩晕，偶有感觉异常、肢体麻木、共济失调、多发性神经炎等，大剂量可致抽搐。(3) 少数病例发生荨麻疹、潮红、瘙痒、膀胱炎、排尿困难、口中金属味及白细胞减少等，均属可逆性，停药后自行恢复。

【用法与用量】(1) 口服：①成人：用于肠道阿米巴病，一次0.4～0.6 g，一日3次，疗程7日；肠道外阿米巴病，一次0.6～0.8 g，一日3次，疗程20日。贾第鞭毛虫病，一次0.4 g，一日3次，疗程5～10日。麦地那龙线虫病，一次0.2 g，疗程7日。小袋虫病，一次0.2 g，一日2次，疗程5日。皮肤利什曼病，一次0.2 g，一日4次，疗程10日。间隔10日后重复一疗程。滴虫病，一次0.2 g，一日4次，疗程7日；可同时用阴道栓剂，每晚0.5 g，连用7～10日。厌氧菌感染，一日0.6～1.2 g，分3次服，疗程7～10日。②儿童：阿米巴病，按体重一日35～50 mg/kg，分3次服，疗程10日。贾第鞭毛虫病、麦地那龙线虫病、小袋虫病、滴虫病按体重一日15～25 mg/kg，分3次服，连服10日。厌氧菌感染，按体重一日20～50 mg/kg。(2) 静脉滴注：厌氧菌感染，成人或儿童，首次按体重15 mg/kg（70 kg成人为1 g），维持量按体重7.5 mg/kg，每6～8小时静脉滴注1次。

【制剂与规格】甲硝唑片：0.2 g。

甲硝唑口含片：① 2.5 mg；② 3 mg。

甲硝唑注射液：① 20 ml∶100 mg；② 100 ml∶0.2 g；③ 100 ml∶0.5 g；④ 250 ml∶0.5 g；⑤ 250 ml∶1.25 g。

甲硝唑葡萄糖注射液：250 ml，内含甲硝唑0.5 g、葡萄糖12.5 g。

注射用甲硝唑磷酸二钠：0.915 g。

甲硝唑栓：① 0.5 g；② 1 g。

复方甲硝唑泡腾片：每片含甲硝唑500 mg，人参茎叶皂苷25 mg，维生素E 40 mg。用于滴虫性阴道炎及细菌性阴道

病。临睡前，洗净外阴后，用手指将药栓放入阴道深部，每晚1次，一次1片。7日为1个疗程。

替硝唑[保(乙)]

Tinidazole

【适应证】(1) 各种厌氧菌感染，如败血症、骨髓炎、腹腔感染、盆腔感染、肺支气管感染、肺炎、鼻窦炎、皮肤蜂窝织炎、牙周感染及术后伤口感染。(2) 结肠直肠手术、妇产科手术及口腔手术等的术前预防用药。(3) 肠道及肠道外阿米巴病、阴道滴虫病、贾第虫病、加得纳菌阴道炎等的治疗。(4) 也可作为甲硝唑的替代药用于幽门螺杆菌所致的胃窦炎及消化性溃疡的治疗。

【注意事项】(1) 本品具致癌、致突变作用，但人体中尚缺乏资料。(2) 如疗程中发生中枢神经系统不良反应，应及时停药。(3) 用药期间不应饮用含乙醇的饮料，因可引起体内乙醇蓄积，干扰乙醇的氧化过程，导致双硫仑样反应，患者可出现腹部痉挛、恶心、呕吐、头痛、面部潮红等。(4) 肝功能减退者本品代谢减慢，药物及其代谢物易在体内蓄积，应予减量，并做血药浓度监测。(5) 替硝唑可自胃液持续清除，某些放置胃管做吸引减压者，可引起血药浓度下降。血液透析时，本品及代谢物迅速被清除，故应用时不需减量。(6) 念珠菌感染者应用本品，其症状会加重，需同时给抗真菌治疗。(7) 替硝唑对阿米巴包囊作用不大，宜加用杀包囊药物。(8) 治疗阴道滴虫病时，需同时治疗其性伴侣。(9) 可透过胎盘屏障，迅速进入胎儿循环。动物实验发现腹腔给药对胎仔具有毒性，而口服给药无毒性。本品对胎儿的影响尚无足够和严密的对照观察，因此妊娠3个月内应禁用。3个月以上的孕妇只有具明确指征时才选用。(10) 替硝唑在乳汁中浓度与血中浓度相似。动物实验显示本品对幼鼠具致癌作用，故哺乳期妇女应避免使用。若必须用药，应暂停哺乳，并在停药3日后方可哺乳。(11) 老年人由于肝功能减退，应用本品时药动学有所改变，需监测血药浓度。

【禁忌证】(1) 对替硝唑或吡咯类药物过敏患者禁用。(2) 有活动性中枢神经疾病和血液病者禁用。(3) 12岁以下患者禁用。

【不良反应】(1) 不良反应少见而轻微，主要为恶心、呕吐、上腹痛、食欲下降及口腔金属味，可有头痛、眩晕、皮肤瘙痒、皮疹、便秘及全身不适。此外还可有中性粒细胞减少、双硫仑样反应及黑色尿。(2) 高剂量时也可引起癫痫发作和周围神经病变。(3)偶见滴注部位轻度静脉炎。

【用法与用量】(1) 口服：①厌氧菌感染：一次1g，一日1次，首剂加倍，一般疗程5~6日，或根据病情决定。②预防手术后厌氧菌感染：手术前12小时1次顿服2g。③原虫感染：阴道滴虫病、贾第虫病：单剂量2g顿服，小儿50mg/kg顿服，间隔3～5日可重复1次。肠阿米巴病：一次0.5g，一日2次，疗程5～10日；或一次2g，一日1次，疗程2～3日；小儿一日50mg/kg顿服，连续3日。肠外阿米巴病：一次2g，一日1次，疗程3～5日。(2) 静脉滴注：滴注速度应缓慢，浓度为2mg/ml时，一次滴注时间应不少于1小时，浓度大于2mg/ml时，滴注速度宜再降低1~2倍。药物不应与含铝的针头和套管接触，并避免与其他药物一起滴注。①厌氧菌感染：一次0.8g，一日1次，缓慢静脉滴注，一般疗程5～6日，或根据病情决定。②预防手术后厌氧菌感染：总量1.6g，1次或分2次滴注，第一次于手术前2～4小时，第二次于手术期间或术后12～24小时滴注。(3) 阴道给药：栓剂一次0.2g，一日0.4g。

【制剂与规格】替硝唑片：0.5g。

替硝唑注射液：①100ml：0.4g；②200ml：0.8g。

替硝唑葡萄糖注射液：①100ml，内含替硝唑0.2g、葡萄糖5g；②100ml，内含替硝唑0.4g、葡萄糖5g；③200ml，内含替硝唑0.4g、葡萄糖10g。

替硝唑栓：0.2g。

奥硝唑[保(乙)]

Ornidazole

【适应证】(1) 用于由敏感菌引起的：

①腹膜炎、腹内脓肿、肝脓肿等；②子宫内膜炎、子宫肌炎、输卵管或卵巢脓肿、盆腔软组织感染、嗜血杆菌阴道炎等；③牙周炎、根尖周炎、冠周炎、急性溃疡性龈炎等；④伤口感染、表皮脓肿、褥疮溃疡感染、蜂窝织炎、气性坏疽等；⑤脑膜炎、脑脓肿；⑥败血症、菌血症等。(2) 用于手术前预防感染和手术后厌氧菌感染的治疗。(3) 治疗消化系统严重阿米巴虫病，如阿米巴痢疾、阿米巴肝脓肿等。

【注意事项】(1) 肝损害患者用药每次剂量与正常用量相同，但用药间隔时间要加倍，以免药物蓄积。(2) 使用过程中，如有异常神经症状反应即停药，并进一步观察治疗。(3) 妊娠早期（妊娠前 3 个月）和哺乳期妇女慎用。(4) 儿童慎用，建议 3 岁以下儿童不用。

【禁忌证】(1) 禁用于对本品及其他硝基咪唑类药物过敏的患者。(2) 禁用于脑和脊髓发生病变的患者。(3) 禁用于器官硬化症、造血功能低下、慢性酒精中毒患者。

【不良反应】本品通常具有良好的耐受性，用药期间会出现下列反应：①消化系统，包括轻度胃部不适、胃痛、口腔异味等；②神经系统，包括头痛及困倦、眩晕、颤抖、运动失调、周围神经病、癫痫发作、意识短暂消失、四肢麻木、痉挛和精神错乱等；③过敏反应，如皮疹、瘙痒等；④局部反应，包括刺感、疼痛等；⑤其他，如白细胞减少等。

【用法与用量】将本品溶于适量的 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液、10% 葡萄糖注射液中，最终浓度为 5 mg/ml，静脉滴注，每 100 ml 滴注时间不少于 30 分钟，用量如下：①术前术后预防用药：成人手术前 1 ~ 2 小时静脉滴注 1 g，术后 12 小时静脉滴注 0.5 g，术后 24 小时静脉滴注 0.5 g。②治疗厌氧菌引起的感染：成人起始剂量为 0.5 ~ 1 g，然后每 12 小时静脉滴注 0.5 g，连用 3 ~ 6 日。如患者症状改善，建议改用口服制剂。③治疗严重阿米巴病：起始剂量为 0.5 ~ 1 g，然后每 12 小时 0.5 g，连用 3 ~ 6 日。④儿童剂量为按体重一日 20 ~ 30 mg/kg，每 12 小时静脉滴注一次，滴注时间 30 分钟。

【制剂与规格】奥硝唑注射液：5 ml : 0.5 g。

奥硝唑氯化钠注射液：100 ml ：奥硝唑 0.25 g 与氯化钠 0.825 g。

奥硝唑葡萄糖注射液：100 ml ：奥硝唑 0.5 g 与葡萄糖 5 g。

左奥硝唑[保(乙)]

Levornidazole

【适应证】(1) 由脆弱拟杆菌、狄氏拟杆菌、卵圆拟杆菌、多形拟杆菌、普通拟杆菌、梭状芽胞杆菌、真杆菌、消化球菌和消化链球菌、幽门螺杆菌、黑色素拟杆菌、梭杆菌、牙龈类杆菌等敏感厌氧菌所引起的多种感染性疾病，包括：①腹部感染：腹膜炎、腹内脓肿、肝脓肿等；②盆腔感染：子宫内膜炎、子宫肌炎、输卵管或卵巢脓肿、盆腔软组织感染、嗜血杆菌阴道炎等；③口腔感染：牙周炎、尖周炎、冠周炎、急性溃疡性龈炎等；④外科感染：伤口感染、表皮脓肿、压疮溃疡感染、蜂窝织炎、气性坏疽等；⑤脑部感染：脑膜炎、脑脓肿；⑥败血症、菌血症等严重厌氧菌感染等。(2) 用于手术前预防感染和手术后厌氧菌感染的治疗。

【注意事项】(1) 肝损伤患者可用常用量，但用药间隔时间要加倍。(2) 本品目前仅用于治疗抗厌氧菌感染（具体病种为盆腔炎、附件炎、子宫内膜炎、牙周炎、冠周炎、根尖周炎）。(3) 建议妊娠（特别是妊娠前 3 个月）及哺乳期妇女不宜使用左奥硝唑。对已过了前 3 个月妊娠期的孕妇必须慎重考虑其利弊。(4) 建议 3 岁以下体重低于 6 kg 的儿童慎用。

【不良反应】(1) 消化系统：包括轻度胃部不适、胃痛、口腔异味等。(2) 神经系统：包括头痛及困倦、眩晕、颤抖、四肢麻木、痉挛和精神错乱等。(3) 变态反应：如皮疹、瘙痒等；(4) 局部反应：包括刺感、疼痛等。(5) 其他：白细胞减少等。

【禁忌证】(1) 禁用于对本品及硝基咪唑类药物过敏的患者。(2) 禁用于中枢神经系统有器质性病变的患者，如癫痫患者、各种器官硬化症患者等。(3) 禁用于

造血功能低下患者和慢性酒精中毒患者。

【用法与用量】静脉滴注，每0.5 g于0.5～1小时滴完。(1) 术前术后预防用药：成人，手术前1～2小时静脉滴注1 g，术后12小时静脉滴注0.5 g，术后24小时静脉滴注0.5 g。(2) 治疗厌氧菌引起的感染：成人，起始剂量0.5～1 g，然后每12小时静脉滴注0.5 g，连用5～10天。如患者的症状改善，可以改为口服给药，一次0.5 g，每12小时一次。(3) 儿童剂量为一日20～30 mg/kg，每12小时静脉滴注一次。肝脏功能严重受损者，建议给药间期延长1倍。

【制剂与规格】左奥硝唑氯化钠注射液：100 ml，内含左奥硝唑0.5 g与氯化钠0.83 g。

9.3.13 磺胺类药及甲氧苄啶

常用的磺胺类药有磺胺甲噁唑和磺胺嘧啶。甲氧苄啶虽具有一定的抗菌作用，但更重要的是它能增强磺胺类的抗菌作用，因此常将它们制成复方制剂应用，如复方磺胺甲噁唑片和联磺甲氧苄啶片。

磺胺甲噁唑[基(基)]

Sulfamethoxazole

【适应证】用于敏感细菌及其他敏感病原微生物所致的下列感染：①敏感细菌所致的急性单纯性尿路感染。②与甲氧苄啶合用可治疗对其敏感的流感嗜血杆菌、肺炎链球菌和其他链球菌所致的中耳炎。③星形奴卡菌病。④对氯喹耐药的恶性疟疾治疗的辅助用药。⑤与乙胺嘧啶联合用药治疗鼠弓形虫引起的弓形虫病。⑥治疗沙眼衣原体所致宫颈炎和尿道炎和新生儿包涵体结膜炎的次选药物。⑦治疗杜克雷嗜血杆菌所致软下疳的次选药物。⑧敏感脑膜炎奈瑟菌所致的流行性脑脊髓膜炎流行时的预防。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应。对一种磺胺药呈现过敏不知所措患者对其他磺胺药也可能过敏。(2) 肝脏损害。可发生黄疸、肝功能减退，严重者可发生急性重型肝炎。故有肝功能损害患者宜避免磺胺药的全身应用。(3) 肾脏损害。如应用本品疗程长，剂量大量宜同服碳酸氢钠并多饮水，以防止此不良反应。失水、休克和老年患者应用本品易致肾损害，应慎用或避免应用本品。肾功能减退患者不宜应用本品。(4) 对呋塞米、砜类、噻嗪类利尿药、磺脲类、碳酸酐酶抑制药呈现过敏的患者，对磺胺药亦可过敏。(5) 下列情况应慎用缺乏G-6-PD、血卟啉症患者。(6) 治疗中须注意检查：①全血象检查，对接受较长疗程的患者尤为重要。②治疗中定期尿液检查。③肝、肾功能检查。

【禁忌证】对磺胺类药过敏者、巨幼红细胞性贫血患者、孕妇、哺乳期妇女、小于2个月的婴儿和重度肝肾功能损害者禁用。

【不良反应】(1) 过敏反应较为常见，可表现为药疹，严重者可发生渗出性多形红斑、剥脱性皮炎和大疱表皮松解萎缩性皮炎等；也有表现为光敏反应、药物热、关节及肌肉疼痛、发热等血清病样反应。(2) 中性粒细胞减少或缺乏症、血小板减少症及再生障碍性贫血。患者可表现为咽痛、发热、苍白和出血倾向。(3) 溶血性贫血及血红蛋白尿。缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶患者应用磺胺药后易发生，在新生儿和小儿中较成人为多见。(4) 高胆红素血症和新生儿核黄疸。由于磺胺药与胆红素竞争蛋白结合部位。可致游离胆红素增高。新生儿肝功能不完善，故较易发生高胆红素血症和新生儿黄疸，偶可发生核黄疸。(5) 可发生黄疸、肝功能减退，严重者可发生急性重型肝炎。(6) 由于本品在尿中溶解度较高（游离型和乙酰化物），故结晶尿与血尿少见。偶有患者发生间质性肾炎或肾小管坏死等严重不良反应。(7) 恶心、呕吐、胃纳减退、腹泻、头痛、乏力等，一般症状轻微，不影响继续用药。偶有患者发生艰难梭菌肠炎，此时需停药。(8) 甲状腺肿大及功能减退偶有发生。(9) 中枢神经系统毒性反应偶可发生，表现为精神错乱、定向力障碍、幻觉、欣快感或抑郁感。一旦出现均需立即停药。

【用法与用量】口服：①成人常用量，用于治疗一般感染，首剂2 g，以后一日2 g，分2次服用。②小儿常用量，用于治疗2个月以上婴儿及小儿的一般感染。首剂按体重一日50～60 mg/kg（总

剂量不超过一日2g)，以后一日按50～60mg/kg，分2次服用。

【制剂与规格】磺胺甲嘧唑片：0.5g。

复方磺胺甲嘧唑片：磺胺甲嘧唑0.4g和甲氧苄啶80mg；口服：成人用于细菌性感染，一次2片（粒)，每12小时1次，首次剂量加倍。用于卡氏肺孢子虫肺炎，一次SMZ 18.75～25mg/kg和TMP 3.75～5mg/kg，每6小时1次。用于预防，初始剂量一次2片（粒)，一日2次，继以相同剂量一日服1次，或一周服3次。

小儿复方磺胺甲嘧唑片：磺胺甲嘧唑0.1g和甲氧苄啶20mg。用于细菌感染，2个月以上体重40kg以下的儿童，按体重一次SMZ 20～30mg/kg及TMP4～6mg/kg，每12小时1次；体重≥40kg的儿童剂量同成人。对2个月以下婴儿禁用。

复方磺胺甲嘧唑分散片：①磺胺甲嘧唑0.4g和甲氧苄啶80mg；②磺胺甲嘧唑0.1g和甲氧苄啶20mg。

复方磺胺甲嘧唑胶囊：①磺胺甲嘧唑0.4g和甲氧苄啶80mg；②磺胺甲嘧唑0.2g和甲氧苄啶40mg。

复方磺胺甲嘧唑口服混悬液：①磺胺甲嘧唑4%和甲氧苄啶0.8%。②磺胺甲嘧唑8%和甲氧苄嘧啶1.6%。

复方磺胺甲嘧唑注射液：2ml：磺胺甲嘧唑0.4g和甲氧苄啶0.08g。肌内注射，成人一次2ml（1支)，一日1～2次。2个月以下婴儿禁用。儿童2个月以上体重40kg以下小儿按体重一次SMZ 8～12mg/kg及TMP 1.6～2.4mg/kg，每12小时1次；体重40kg以上小儿的剂量同成人。

磺胺嘧啶[保(甲)]

Sulfadiazine

【适应证】用于敏感细菌及其他敏感病原微生物所致的感染。①脑膜炎球菌所致的流行性脑脊髓膜炎的治疗和预防。②与甲氧苄啶合用治疗对其敏感的流感嗜血杆菌、肺炎链球菌和其他链球菌所致的中耳炎、皮肤软组织感染、急性支气管炎和肺部感染。③星形奴卡菌病。④对氯喹耐药的恶性疟疾的辅助治疗。⑤沙眼衣原体所致宫颈炎、尿道炎和新生儿包涵体结膜炎。⑥与乙胺嘧啶联合用药治疗鼠弓形虫引起的弓形虫病。

【禁忌证】对磺胺类药过敏者、孕妇、哺乳期妇女、小于2个月以下婴儿和肝、肾功能不良者禁用。

【注意事项】(1）缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶、血卟啉症、失水、休克和老年患者慎用。(2）对一种磺胺药呈现过敏的患者对其他磺胺药可能过敏。(3）对呋塞米、砜类、噻嗪类利尿药、磺酰脲类、碳酸酐酶抑制药呈现过敏的患者，对磺胺药亦可能过敏。(4）应饮用足量水分，使成人一日尿量至少维持在1 200ml以上。如疗程长、剂量大时除多饮水外宜同服碳酸氢钠。(5）治疗中须注意检查：①全血象检查，对接受较长疗程的患者尤为重要。②治疗中定期尿液检查（每2～3日查尿常规一次）以发现长疗程或高剂量治疗时可能发生的结晶尿。③肝、肾功能检查。(6）严重感染者应测定血药浓度，对大多数感染性疾患游离磺胺浓度达50～150μg/ml（严重感染120～150μg/ml）可有效。总磺胺血浓度不应超过200μg/ml，如超过此浓度，不良反应发生率增高。(7）在尿中溶解度低，易出现结晶尿，不推荐用于尿路感染。(8）不可任意加大剂量、增加用药次数或延长疗程，以防蓄积中毒。(9）本品能抑制大肠埃希菌的生长，妨碍B族维生素的肠内合成，使用1周以上者，应同时给予维生素B预防。(10）注射液仅供重患者应用，病情改善后应尽早改为口服给药。注射液，不宜做皮下或鞘内注射。

【不良反应】(1）过敏反应较为常见，可表现为药疹，严重者可发生渗出性多形红斑、剥脱性皮炎和大疱表皮松解萎缩性皮炎等；也有表现为光敏反应、药物热、关节及肌肉疼痛、发热等血清病样反应。(2）中性粒细胞减少或缺乏症、血小板减少症及再生障碍性贫血。患者可表现为咽痛、发热、苍白和出血倾向。(3）溶血性贫血及血红蛋白尿。缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶患者应用磺胺药后易发生，在新生儿和小儿中较成人为多见。(4）高胆红素血症和新生儿核黄疸。由于磺胺药与胆红素竞争蛋白结合部位。可致游离胆红素增

高。新生儿肝功能不完善，故较易发生高胆红素血症和新生儿黄疸，偶可发生核黄疸。(5) 肝脏损害。可发生黄疸、肝功能减退，严重者可发生急性重型肝炎。(6) 肾脏损害。可发生结晶尿、血尿和管型尿。偶有患者发生间质性肾炎或肾小管坏死等严重不良反应。(7) 恶心、呕吐、食欲减退、腹泻、头痛、乏力等，一般症状轻微，不影响继续用药。偶有患者发生艰难梭菌肠炎，此时需停药。(8) 甲状腺肿大及功能减退偶有发生。(9) 中枢神经系统不良反应偶可发生，表现为精神错乱、定向力障碍、幻觉、欣快感或抑郁感。

【用法与用量】(1) 口服：用于一般感染。成人一次 1 g，一日 2 次，首次剂量加倍。2 个月以上婴儿及小儿常用量口服，按体重一次 25 ~ 30 mg/kg，一日 2 次，首次剂量加倍（总量不超过 2 g）；用于预防流行性脑脊髓膜炎，成人一次 1g，一日 2 次，疗程 2 日。2 个月以上婴儿及小儿，一日 0.5 g，疗程 2 ~ 3 日。(2) 缓慢静脉注射或静脉滴注：用于严重感染，如流行性脑脊髓膜炎。成人首剂 50 mg/kg，继以一日 100 mg/kg，分 3 ~ 4 次静脉滴注或缓慢静脉注射。2 个月以上小儿，一般感染，一日 50 ~ 75 mg/kg，分 2 次应用。流行性脑脊髓膜炎，一日 100 ~ 150 mg/kg，分 3 ~ 4 次静脉滴注或缓慢静脉注射。以注射用水或 0.9% 氯化钠注射液稀释成 5% 的溶液，缓慢静脉注射；静脉滴注浓度约为 1%。

【制剂与规格】磺胺嘧啶片：0.5 g。

磺胺嘧啶混悬液：10%。

注射用磺胺嘧啶钠：① 0.4 g；② 1 g。

甲氧苄啶 [保（乙）]

Trimethoprim

【适应证】用于敏感的大肠埃希菌、奇异变形杆菌、肺炎克雷伯菌和某些肠杆菌属和腐生葡萄球菌等细菌所致的急性单纯性下尿路感染初发病例。很少单用，一般均与磺胺药，如磺胺甲噁唑或磺胺嘧啶合用。

【注意事项】(1) 肝或肾功能损害、叶酸缺乏的巨幼细胞贫血或其他血液系统疾病患者慎用。(2) 用药期间应定期进行周围血象检查，在疗程长、用药量大、老年、营养不良及服用抗紫癜药者易出现叶酸缺乏症，如周围血象中白细胞或血小板等已明显减少则需停用。(3) 本品易产生耐药性，一般不单独使用。(4) 本品可空腹服用，如有胃肠道刺激症状时也可与食物同服。(5) 如因服用本品引起叶酸缺乏时，可同时服用叶酸制剂。如有骨髓抑制征象发生，应即停用本品，并给予叶酸治疗。(6) 孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、新生儿、早产儿、2 个月以下婴儿、严重肝肾疾病、白细胞减少、血小板减少和紫癜等患者禁用。

【不良反应】(1) 由于本品对叶酸代谢的干扰可产生血液系统不良反应，可出现白细胞减少，血小板减少或高铁血红蛋白性贫血。一般白细胞及血小板轻度减少，及时停药可望恢复，也可加用叶酸。(2) 过敏反应：可发生瘙痒、皮疹、偶可呈严重的渗出性多形红斑。(3) 恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应，一般症状轻微。(4) 偶可发生无菌性脑膜炎，有头痛、颈项强直、恶心等表现。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 0.1 g，每 12 小时 1 次；或一次 0.2 g，一日 1 次，疗程 7 ~ 10 日。肾功能损害患者需按肌酐清除率调节剂量。每分钟 > 30 ml 者仍用成人常用量；每分钟 15 ~ 30 ml 者，每 12 小时 50 mg；每分钟 < 15 ml 者不宜用。(2) 静脉滴注：一次 30 ~ 100 mg，一日 80 ~ 200 mg。

【制剂与规格】甲氧苄啶片：0.1 g。

联磺甲氧苄啶片 每片含磺胺甲噁唑 200 mg、磺胺嘧啶 200 mg 和甲氧苄啶 80 mg。口服：成人一次 2 片，一日 2 次，首剂加倍。用于慢性支气管炎急性发作疗程至少 10 ~ 14 日；尿路感染疗程 7 ~ 10 日；细菌性痢疾 5 ~ 7 日；急性中耳炎 10 日。

9.3.14 氟喹诺酮类

喹诺酮类抗菌药吡哌酸具有一定的抗革兰阴性菌和抗假单胞菌活性，可用于治疗尿路感染和肠道感染。采用氟原子和哌

嗪环取代4-喹诺酮结构后合成第一个氟喹诺酮类药—诺氟沙星，此后，又相继合成一系列含氟喹诺酮类衍生物，统称为氟喹诺酮类。氟喹诺酮类抗菌药物具有下列共同特点：①抗菌谱广，对需氧革兰阳、阴性菌均具良好抗菌作用，尤其对革兰阴性杆菌具强大抗菌活性；②体内分布广，在多数组织体液中药物浓度高于血浆浓度，可达有效抑菌或杀菌水平；③血浆半衰期较长，可减少服药次数，使用方便；④多数品种有口服及注射剂，对于重症或不能口服用药患者可先静脉给药，病情好转后改为口服进行序贯治疗；⑤不良反应大多程度较轻，患者易耐受。

吡哌酸[保(甲)]

Pipemidic Acid

【适应证】用于敏感菌革兰阴性杆菌所致的尿路感染、细菌性肠道感染。

【不良反应】主要为恶心、嗳气、上腹不适、食欲减退、稀便或便秘等胃肠道反应，皮疹或全身瘙痒少见；偶见眩晕、头痛、血清ALT及AST一过性升高等。停药后可自行恢复。

【禁忌证】禁用于对本品和萘啶酸过敏的患者。孕妇、哺乳期妇女禁用。18岁以下小儿及青少年禁用。

【注意事项】(1) 本品可与饮食同服，以减少胃肠道反应。(2) 长期应用，宜定期监测血常规和肝、肾功能。(3) 患中枢神经系统疾病者，如癫痫或癫痫病史者避免应用，确有指征应用时，宜在严密观察下慎用。(4) 严重肝、肾功能减退者慎用。(5) 老年患者宜根据肾功能调整给药剂量。

【用法用量】口服，成人，一次0.5 g，一日1～2 g。

【制剂与规格】吡哌酸片：① 0.25 g；② 0.5 g。

吡哌酸胶囊：0.25 g。

诺氟沙星[基(基)，保(甲/乙)]

Norfloxacin

【适应证】用于敏感菌所引起的呼吸道、泌尿道、胃肠道感染，如急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、肺炎、急慢性肾盂肾炎、膀胱炎、伤寒等。

【注意事项】(1) 不宜静脉注射，静脉滴注速度不宜过快。(2) 大肠埃希菌对诺氟沙星耐药者多见，应在给药前留取尿培养标本，参考细菌药敏结果调整用药。(3) 大剂量应用或尿pH在7以上时可发生结晶尿。宜多进水，保持24小时排尿量在1 200 ml以上。(4) 肾功能减退者，根据肾功能调整剂量。(5) 本类药物可引起中、重度光敏反应。应避免过度暴露于阳光，发生后需停药。(6) 严重肝功能减退或肝肾功能均减退者，其血药浓度增高，故均需权衡利弊后应用，并调整剂量。(7) 原有中枢神经系统疾病者，如癫痫及癫痫病史者均应避免应用，有指征时需仔细权衡利弊后应用。(8) 老年患者常有肾功能减退，因本品部分经肾排出，需减量应用。(9) 极个别缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶的患者可能发生溶血反应。(10) 可致重症肌无力症状加重，呼吸肌无力而危及生命，慎用。(11) 不应与茶碱同时使用。

【禁忌证】(1) 对诺氟沙星及任何一种其他喹诺酮类药过敏者禁用。(2) 孕妇、哺乳期妇女、18岁以下儿童禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道反应：较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。(2) 中枢神经系统反应：可有头晕、头痛、嗜睡或失眠。(3) 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒、面部潮红、胸闷等，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。(4) 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。(5) 少数患者可发生ALT及AST升高、血尿素氮增高及周围血象白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

【用法与用量】(1) 口服：用于成人。①大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌及奇异变形菌所致的急性单纯性下尿路感染，一次400 mg，一日2次，疗程3日。②其他病原菌所致的单纯性尿路感染，剂量同上，疗程7～10日。③复杂性尿路感染，剂量同上，疗程10～21日。④单纯性淋球菌性尿道炎，单次800～1 200 mg。⑤急性

及慢性前列腺炎，一次 400 mg，一日 2 次，疗程 28 日。⑥肠道感染，一次 300～400 mg，一日 2 次，疗程 5～7 日。⑦伤寒沙门菌感染，一日 800～1 200 mg，分 2～3 次服用，疗程 14～21 日。(2) 静脉滴注：用于成人。①以 0.2 g 稀释于 5% 葡萄糖注射液 250 ml 中使用，1.5～2 小时滴完，一日 2 次。②严重病例 0.4 g 稀释于 5% 葡萄糖注射液 500 ml 中使用，3～4 小时滴完，一日 2 次。③急性感染一般 7～14 日为 1 个疗程，慢性感染 14～21 日为 1 个疗程，或遵医嘱。(3) 阴道给药：①栓剂：每晚临用前清洗外阴部，取栓剂一粒，置入阴道深部，一日 1 次，连用 7 日。或遵医嘱。②膜剂：使用前先洗净外阴，将手洗净擦干，取出药膜 1 片（或 2 片）经折叠成松软小团后，以示指和中指夹持（或中指）推入阴道深处，早、晚各 1 次，一次 20～40 mg（1～2 片）。

【制剂与规格】诺氟沙星注射液：①2 ml∶0.1 g；②2 ml∶0.2 g；③10 ml∶0.2 g；④20 ml∶0.4 g。

诺氟沙星葡萄糖注射液：100 ml，内含诺氟沙星 0.2 g、葡萄糖 2 g。

诺氟沙星片：0.1 g。

诺氟沙星胶囊：0.1 g。

诺氟沙星药膜：20 mg。

诺氟沙星栓：0.2 g。

氧氟沙星[保(甲/乙)]

Ofloxacin

【适应证】用于敏感菌所引起的各种感染。①泌尿生殖系统感染，包括单纯性及复杂性尿路感染、细菌性前列腺炎、淋病奈瑟菌尿道炎或宫颈炎（包括产酶株所致者）。②呼吸道感染，包括敏感革兰阴性杆菌所致支气管感染急性发作及肺部感染及结核分枝杆菌引起的感染。③胃肠道感染，由志贺菌属、沙门菌属、产肠毒素大肠埃希菌、亲水气单胞菌、副溶血弧菌等所致。④伤寒。⑤骨和关节感染。⑥皮肤软组织感染。⑦败血症等全身感染。

【注意事项】(1) 每 0.2 g 静脉滴注时间不得少于 30 分钟。(2)～(8) 见诺氟沙星的注意事项。

【禁忌证】对本品及喹诺酮类药过敏的患者。妊娠及哺乳期妇女、18 岁以下儿童。

【不良反应】见诺氟沙星的不良反应。

【用法与用量】口服或静脉缓慢滴注：①支气管感染、肺部感染，成人一次 0.3 g，一日 2 次，疗程 7～14 日。②急性单纯性下尿路感染，成人一次 0.2 g，一日 2 次，疗程 5～7 日。③复杂性尿路感染，成人一次 0.2 g，一日 2 次，疗程 10～14 日。④前列腺炎，成人一次 0.3 g，一日 2 次，疗程 6 周；衣原体宫颈炎或尿道炎，一次 0.3 g，一日 2 次，疗程 7～14 日。⑤单纯性淋病，成人一次 0.4 g，单剂量。⑥伤寒，成人一次 0.3 g，一日 2 次，疗程 10～14 日。⑦铜绿假单胞菌感染或较重感染，剂量可增至成人一次 0.4 g，一日 2 次。

【制剂与规格】氧氟沙星片：0.1 g。

氧氟沙星颗粒（按氧氟沙星计）：0.1 g。氧氟沙星注射液：100 ml，内含氧氟沙星 0.2 g、氯化钠 0.9 g。

氧氟沙星葡萄糖注射液：①200 ml，内含氧氟沙星 0.2 g、葡萄糖 10 g；②100 ml，内含氧氟沙星 0.2 g、葡萄糖 5 g；③250 ml，内含氧氟沙星 0.2 g、葡萄糖 5 g。

环丙沙星[基(基)，保(甲/乙)]

Ciprofloxacin

【适应证】用于敏感菌感染所引起的各种感染。①泌尿生殖系统感染，包括单纯性、复杂性尿路感染、细菌性前列腺炎、淋病奈瑟菌尿道炎或宫颈炎（包括产酶株所致者）。②呼吸道感染，包括敏感革兰阴性杆菌所致支气管感染急性发作及肺部感染。③胃肠道感染，由志贺菌属、沙门菌属、产肠毒素大肠埃希菌、亲水气单胞菌、副溶血弧菌等所致。④伤寒。⑤骨和关节感染。⑥皮肤软组织感染。⑦败血症等全身感染。

【注意事项】(1) 宜空腹服用，食物虽可延迟其吸收，但其总吸收量（生物利用度）未见减少，故也可于餐后服用，以减少胃肠道反应；服用时宜同时饮水 250 ml。(2)～(8)见诺氟沙星的不良反应。

【禁忌证】对环丙沙星及任何一种氟喹诺酮类药过敏的患者禁用。孕妇、哺乳

期妇女及18岁以下者禁用。

【不良反应】见诺氟沙星的不良反应。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量一日0.5～1.5g，分2～3次。②用于骨和关节感染，一日1～1.5g，分2～3次，疗程4～6周或更长。③肺炎和皮肤软组织感染，一日1～1.5g，分2～3次，疗程7～14日。④肠道感染，一日1g，分2次，疗程5～7日。⑤伤寒，一日1.5g，分2～3次，疗程10～14日。⑥尿路感染，急性单纯性下尿路感染，一日0.5g，分2次，疗程5～7日；复杂性尿路感染，一日1g，分2次，疗程7～14日。(2) 静脉滴注：成人：①常用量一日0.2g，每12小时静脉滴注1次，滴注时间不少于30分钟。严重感染或铜绿假单胞菌感染可加大剂量至一日0.8g，分2次静脉滴注。②注射用环丙沙星使用时，将其于无菌操作下溶于5%葡萄糖注射液200ml或0.9%氯化钠注射液200ml中。③疗程：尿路感染，急性单纯性下尿路感染5～7日；复杂性尿路感染7～14日。肺炎和皮肤软组织感染、伤寒，7～14日。肠道感染，5～7日。骨和关节感染，4～6周或更长。单纯性淋病，单次口服0.5g。(3) 阴道给药：患者清洁外阴部后，取仰卧位，垫高臀部，将栓剂或膜剂(0.1g)塞入阴道深部，保留5～10分钟。每晚1次，一次1枚，疗程7日。

【制剂与规格】盐酸环丙沙星片（按环丙沙星计）：0.25g。

盐酸环丙沙星胶囊：0.25g。

环丙沙星注射液：100ml：0.2g。

环丙沙星葡萄糖注射液：100ml：0.2g。

乳酸环丙沙星注射液：① 100ml：0.1g；② 100ml：0.2g；③ 250ml：0.25g。

乳酸环丙沙星0.9%氯化钠注射液：① 100ml：0.2g；② 200ml：0.4g。

注射用乳酸环丙沙星（以环丙沙星计）：① 0.2g；② 0.4g。

乳酸环丙沙星阴道泡腾片（以环丙沙星计）：0.1g。

盐酸环丙沙星栓：0.2g。

左氧氟沙星[基(基)，保(甲/乙)]

Levofloxacin

【适应证】用于敏感细菌感染所引起的中、重度感染。①呼吸系统感染：包括敏感革兰阴性杆菌所致急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、弥漫性支气管炎、支气管扩张合并感染、肺炎、扁桃体炎（扁桃体周围脓肿）。②泌尿系统感染：肾盂肾炎、复杂性尿路感染等。③生殖系统感染：急性前列腺炎、急性附睾炎、宫腔感染、子宫附件炎、盆腔炎（疑有厌氧菌感染时可合用甲硝唑）、淋病奈瑟菌尿道炎或宫颈炎（包括产酶株所致者）。④皮肤软组织感染：传染性脓疱病、蜂窝织炎、淋巴管（结）炎、皮下脓肿、肛脓肿等。⑤肠道感染：细菌性痢疾、感染性肠炎、沙门菌属肠炎、伤寒及副伤寒。⑥败血症、粒细胞减少及免疫功能低下患者的各种感染。⑦其他感染：乳腺炎、外伤、烧伤及手术后伤口感染、腹腔感染（必要时合用甲硝唑）、胆囊炎、胆管炎、骨与关节感染及五官科感染等。

【注意事项】(1) 静脉滴注时间为每100ml至少60分钟。本制剂不宜与其他药物同瓶混合静滴，或在同一根静脉输液管内进行静滴。(2)～(8) 见诺氟沙星的注意事项。(9) 肾功能不全者按肌酐清除率应减量或延长给药间隔时间：每分钟20～49ml者，首剂0.4g，以后每24小时0.2g；每分钟10～19ml者，首剂0.4g，以后每48小时0.2g。(10) 偶见用药后发生跟腱炎或跟腱断裂的报告，故如有上述症状发生时须立即停药并休息，严禁运动，直到症状消失。

【禁忌证】对左氧氟沙星及氟喹诺酮类药过敏者。妊娠及哺乳期妇女、18岁以下儿童。

【不良反应】见诺氟沙星的不良反应。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量为一日0.3～0.4g，分2～3次服或0.3～0.5g一次口服。用于支气管感染、肺部感染：1次0.2g，一日2次，或1次0.1g，一日3次，疗程7～14日。用于急性单纯性下尿路感染：1次0.1g，一日2次，疗程5～7日，复杂性尿路感

染：一次0.2g，一日2次，或1次0.1g，一日3次，疗程为10～14日。②细菌性前列腺炎：一次0.2g，一日2次，疗程为6周。③感染较重或感染病原体敏感性较差者，如铜绿假单胞菌等假单胞菌属细菌感染的治疗剂量也可增至一日0.6g，分3次服。(2) 静脉滴注：成人一日0.4～0.5g，分1～2次滴注。重度感染患者及病原菌对本品敏感性较差者（如铜绿假单胞菌），一日最大剂量可增至0.6g，分2次滴注。

【制剂与规格】左氧氟沙星片：①0.1g；②0.2g；③0.5g。

盐酸左氧氟沙星分散片（以左氟沙星计）：0.1g。

盐酸左氧氟沙星胶囊：0.1g。

甲磺酸左氧氟沙星片：0.1g。

左氧氟沙星注射液：①100ml：0.3g；②50ml：0.1g。

乳酸左氧氟沙星注射液：2ml：0.1g。

盐酸左氧氟沙星注射液：①2ml：0.1g；②2ml：0.1g。

甲磺酸左氧氟沙星注射液：100ml：0.2g。

盐酸左氧氟沙星0.9%氯化钠注射液：①100ml，内含氧氟沙星0.1g、氯化钠0.9g；②100ml，内含左氧氟沙星0.2g、氯化钠0.9g；③100ml，内含左氧氟沙星0.3g、氯化钠0.9g；④100ml，内含左氧氟沙星0.5g、氯化钠0.9g。

注射用盐酸左氧氟沙星：①0.2g；②0.3g；③0.4g。

注射用乳酸左氧氟沙星：①0.2g；②0.3g。

乳酸左氧氟沙星0.9%氯化钠注射液：①100ml，内含乳酸左氧氟沙星0.2g、氯化钠0.9g；②200ml，内含乳酸左氧氟沙星0.2g、氯化钠0.9g；③100ml，内含乳酸左氧氟沙星0.3g、氯化钠0.9g。

乳酸左氧氟沙星葡萄糖注射液：100ml，内含乳酸左氧氟沙星0.3g、葡萄糖5.0g。

氟罗沙星[保(乙)]

Fleroxacin

【适应证】对本品敏感细菌引起的急性支气管炎，慢性支气管炎急性发作及肺炎等呼吸系统感染；膀胱炎、肾盂肾炎、前列腺炎、附睾炎、淋病奈瑟菌性尿道炎等泌尿生殖系统感染；伤寒沙门菌感染、细菌性痢疾等消化系统感染；皮肤软组织感染、骨感染、腹腔感染及盆腔感染等。

【注意事项】(1) 肾功能减退者慎用，或根据减退程度调整剂量。(2) 肝功能不全者慎用，如应用应注意监测肝功能。(3) 原有中枢神经系统疾患者，包括脑动脉硬化或癫痫病史者均应避免应用，有指征时权衡利弊应用。(4) 喹诺酮类药物间存在交叉过敏反应，对任何一种喹诺酮类过敏者不宜使用本品。(5) 患者的尿pH在7以上时易发生结晶尿，故每日饮水量必须充足。(6) 本品可引起光敏反应，至少在光照后12小时才可接受治疗，治疗期间及治疗后数日内应避免过长时间暴露于明亮光照下。出现光敏反应指征如皮肤灼热、发红、肿胀、水泡、皮疹、瘙痒、皮炎时，应停止治疗。(7) 老年患者肾功能有所减退，用药量应酌减。

【禁忌证】(1) 对本品或喹诺酮类药物过敏者禁用。(2) 妊娠、哺乳期妇女及18岁以下儿童禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心呕吐、食欲缺乏等。(2) 中枢神经系统反应可有头晕、头痛、兴奋、嗜睡或失眠。(3) 变态反应有皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。(4) 少数患者可发生血清氨基转移酶、血尿素氮增高，周围血象白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。(5) 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识模糊、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③结晶尿，多见于高剂量应用时；④关节疼痛。

【用法与用量】口服：成人，一日0.2～0.4g，分1～2次服，疗程7～14日。

【制剂与规格】氟罗沙星片：0.1g。

吉米沙星[保(乙)]

Gemifloxacin

【适应证】用于：①慢性支气管炎急性发作期；②用于社区获得性肺炎。

【注意事项】(1) 交叉过敏：本药与其他氟喹诺酮类药物可能存在交叉过敏。(2) 以下情况慎用：① QT 间期延长、心动过缓、急性心肌缺血等心脏疾病患者；②葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏症患者；③患中枢神经系统疾病者(如癫痫)；④低钾血症及低镁血症者。(3) 用药前后及用药时应当检查或监测：①全血细胞计数及白细胞分类；②细菌培养及药敏试验；③血药浓度监测(尤其是严重感染者)；④尿液分析。

【禁忌证】对本药或其他氟喹诺酮类药物过敏者，妊娠及哺乳期妇女，18 岁以下儿童。

【不良反应】(1) 心血管系统：可能使 QT 间期延长，尤其是有 QT 间期延长史、电解质紊乱、正在使用 IA 或 III 类抗心律失常药物或其他可延长 QT 间期的药物、心动过缓、急性心肌梗死等患者。(2) 中枢神经系统：可引起头痛、眩晕。(3) 消化系统：腹泻、恶心、腹痛、呕吐等胃肠道症状，ALT、AST 升高。(4) 血液：葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏症患者使用本药时发生溶血的危险增加。(5) 皮肤：皮疹。(7) 光敏反应较少见。

【用法与用量】口服。(1) 成人常用量①慢性支气管炎急性发作期，一次 320 mg，一日 1 次，疗程 5 日；②社区获得性肺炎，一次 320 mg，一日 1 次，疗程 7 日。(2) 肾功能不全时剂量：肌酐清除率大于每分钟 40 ml 的患者，不需调整剂量。肌酐清除率小于每分钟 40 ml 的患者，可一次 160 mg，一日 1 次。(3) 肝功能不全时剂量：肝功能不全者(包括 Child-Pugh 分级为 B、C 级者)，不需调整剂量。(4) 透析时剂量：接受血液透析或腹膜透析的患者，可一次 160 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】甲磺酸吉米沙星片：320 mg。

洛美沙星[医(乙)]

Lomefloxacin

【适应证】对本品敏感细菌引起的感染：(1) 呼吸道感染：慢性支气管炎急性发作、支气管扩张伴感染、急性支气管炎、肺炎等。(2) 泌尿生殖系统感染：急性膀胱炎、急性肾盂肾炎、复杂性尿路感染、慢性尿路感染急性发作、急慢性前列腺炎、单纯性淋病等。(3) 腹腔、胆道、肠道、伤寒等感染。(4) 皮肤软组织感染。(5) 其他感染，如鼻窦炎、中耳炎、眼睑炎等。

【注意事项】(1) 肾功能减退者或肝功能不全者慎用，若使用，应注意监测肝、肾功能。(2) 本品每次滴注时间不少于 60 分钟。(3) 本品可引起光敏反应。(4) 当出现皮肤灼热、发红、肿胀、水疱、皮疹、瘙痒及皮炎时应停止治疗。(5) 老年患者肾功能减退，用药量应酌减。

【禁忌证】对本品或其他喹诺酮类药物过敏者禁用。孕妇、哺乳期妇女禁用。18 岁以下患者禁用。

【不良反应】口服时个别患者可出现中上腹部不适、纳差、恶心、口干、轻微头痛、头晕等症状，偶可出现皮疹、皮肤瘙痒等过敏反应和心悸、胸闷等，偶有 ALT、AST 或尿素氮(BUN)值升高。

【用法与用量】(1) 口服：一日 0.6 g，分 2 次服；病情较重者可增至一日 0.8 g，分 2 次服。①单纯性尿路感染：一次 0.4 g，一日 1 次。②单纯性淋病：一日 0.6 g，分 2 次口服。(2) 静脉滴注：一次 0.2 g，一日 2 次，加入 5%葡萄糖或氯化钠注射液 250 ml 中静脉滴注，每瓶滴注时间 60 分钟左右。尿路感染一次 0.1 g，每 12 小时 1 次，用法同上，疗程 7～14 日。

【制剂与规格】盐酸洛美沙星片：① 0.1 g；② 0.2 g；③ 0.3 g；④ 0.4 g。

盐酸洛美沙星胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g。

盐酸洛美沙星注射液：① 2 ml ：0.1 g；② 10 ml ：0.1 g；③ 100 ml ：0.2 g；④ 250 ml ：0.2 g。

注射用盐酸洛美沙星：① 50 mg；② 100 mg；③ 200 mg。

盐酸洛美沙星葡萄糖注射液：250 ml：洛美沙星 0.2 g，与葡萄糖 12.5 g。

盐酸洛美沙星氯化钠注射液：100 ml：洛美沙星 0.2 g 与氯化钠 0.9 g。

莫西沙星[保(乙)]

Moxifloxacin

【适应证】用于上呼吸道和下呼吸道

感染，如急性窦炎、慢性支气管急性发作、社区获得性肺炎及皮肤和软组织感染。

【注意事项】(1) 可延长一些患者心电图的QT间期。其QT间期延长的程度随着药物浓度的增加而增加。①应避免用于QT间期延长的患者。患有无法纠正的低钾血症及接受Ⅰa类（如奎宁丁、普鲁卡因）或Ⅲ类（如胺碘酮、索托洛尔）抗心律失常药物者。②慎与可能延长QT间期的药物（西沙必利、红霉素、抗精神病药和三环类抗抑郁药）合用。③慎用于有致心律失常的因素存在时，（如严重的心动过缓或急性心肌缺血）。(2) 喹诺酮类使用可诱发癫痫的发作，慎用于已知或怀疑有能导致癫痫发作或降低癫痫发作域值的中枢神经系统疾病的患者。(3) 严重肝功能损伤患者慎用。(4) 可能出现肌腱炎和肌腱断裂，特别是在老年患者和使用激素治疗的患者中。(5) 可能出现假膜性肠炎。(6) 建议患者避免在紫外线及日光下过度暴露。(7) 可能首次服用后就可发生过敏反应和变态反应，应立即告知医生。(8) 治疗复杂盆腔感染患者（如伴有输卵管-卵巢或盆腔脓肿）时，需考虑经静脉给药进行治疗，不推荐口服。

【禁忌证】(1) 对莫西沙星任何成分或其他喹诺酮类或任何辅料过敏者。(2)妊娠和哺乳期妇女。(3)18岁以下儿童。

【不良反应】常见腹痛、头痛、恶心、腹泻、呕吐、消化不良、肝功能化验异常、眩晕等。(1) 少见乏力、念珠菌病、不适心动过速、QT延长、口干、便秘、胃肠失调、白细胞减少、凝血酶原减少、嗜酸细胞增多、肌肉痛、失眠、感觉异常、皮疹等。(2) 偶见过敏反应、外周水肿、胃炎、腹泻（难辨梭状芽胞杆菌）、血小板减少、肝功能异常、肌腱异常、紧张、情绪不稳定、耳鸣、弱视、肾功能异常等。

【用法与用量】(1) 口服：成人，一次400 mg，一日1次。用于慢性气管炎急性发作5日，用于社区获得性肺炎10日、用于急性鼻窦炎7日、用于皮肤和软组织感染7日。(2) 静脉滴注 一次0.4 g，一日1次，滴注90分钟。

【制剂与规格】盐酸莫西沙星片：0.4 g。

盐酸莫西沙星氯化钠：250 ml，内含莫西沙星0.4 g、氯化钠2.25 g。

9.3.15 其他抗菌药物

磷霉素 [基(基)，保(甲/乙)]

Fosfomycin

【适应证】(1) 敏感菌所致的呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染等。(2) 其他抗生素合用于由敏感菌所致重症感染如败血症、腹膜炎、骨髓炎等。

【注意事项】(1) 静脉滴注速度宜缓慢，静脉滴注时间1～2小时。(2) 肝肾功能减退者慎用。应用较大剂量时应监测肝功能。(3) 5岁以上儿童应减量及慎用。(4) 老年人应酌减剂量并慎用。

【禁忌证】对磷霉素过敏者、妊娠及哺乳期妇女、5岁以下儿童。

【不良反应】(1) 主要有恶心、食欲减退、腹部不适、稀便或轻度腹泻。(2) 偶见皮疹，嗜酸性粒细胞增多，红细胞、血小板、白细胞降低，ALT及AST一过性升高，头晕、头痛等反应。(3) 注射部位静脉炎。(4) 极个别患者可能出现休克。

【用法与用量】(1) 口服：成人一日2～4g，分3～4次服。如服用磷霉素氨丁三醇散，一日单剂量空腹服药1次。成人一次6g（相当于磷霉素3g），以适量水溶解后服用。儿童按体重一日50～100 mg/kg，分3～4次服。(2) 静脉滴注：①成人一日4～12g，严重感染可增至一日16g。分2～3次滴注。②儿童按体重一日0.1～0.3g/kg，分2～3次滴注。

【制剂与规格】磷霉素钙片（以磷霉素计）：①0.1g；②0.2g；③0.5g。

磷霉素钙胶囊：0.1g。

磷霉素钙颗粒剂：0.5g。

磷霉素氨丁三醇散：6g（相当于磷霉素3g）。

注射用磷霉素钠：①1g（100万U）；②2g（200万U）；③4g（400万U）。

夫西地酸 [保(乙)]

Fusidic Acid

【适应证】用于敏感细菌，尤其是葡

萄球菌引起的各种感染，如骨髓炎、败血症、心内膜炎，反复感染的囊性纤维化、肺炎、皮肤及软组织感染，外科及创伤性感染等。

【注意事项】(1) 肝功能不全和胆道异常的患者长期大剂量用药或联合其他排泄途径相似的药物（如林可霉素或利福平）时，应定期检查肝功能。(2) 早产儿、黄疸、酸中毒及严重病弱的新生儿使用时需留意有无核黄疸症状。(3) 静脉注射时不能与卡那霉素、庆大霉素、万古霉素、头孢噻啶或阿莫西林混合；亦不可与全血、氨基酸溶液或含钙溶液混合。当溶液的 pH 低于 7.4 时，会发生沉淀。

【禁忌证】对夫西地酸过敏者禁用。妊娠初始 3 个月内禁用。

【不良反应】(1) 静脉滴注可能导致血栓性静脉炎和静脉痉挛。(2) 一日用药 1.5 ~ 3 g 时有可逆性转氨酶增高的报道。大剂量静脉给药时，个别患者用药后出现可逆性黄疸。若黄疸持续不退，需停止使用，血清胆红素会恢复正常。

【用法与用量】(1) 口服：①成人一日 1.5 g，分 3 次服，重症加倍。②儿童可用混悬剂，1 岁以下儿童，按体重一日 50 mg/kg；1 ~ 5 岁，一次 250 mg，5 岁以上按成人量。分次给予。(2) 静脉滴注：①成人一次 0.5 g，一日 3 次。②儿童及婴儿一日按体重 20 mg/kg，分 3 次给药。

【制剂与规格】夫西地酸片：250 mg。

夫西地酸口服混悬液：50 ml : 2.5 g。

注射用夫西地酸钠：① 0.125 g；② 0.5 g。

夫西地酸软膏：15 g : 0.3 g。

利奈唑胺[保(乙)]

Linezolid

【适应证】用于敏感菌引起的感染。①耐万古霉素的屎肠球菌引起的感染，包括并发的菌血症。②致病菌为金黄色葡萄球菌（甲氧西林敏感或耐甲氧西林的菌株）或肺炎链球菌（包括多重耐药菌株）引起的院内获得性肺炎。③金黄色葡萄球菌（甲氧西林敏感或耐甲氧西林的菌株）、化脓链球菌或无乳链球菌引起的复杂性皮肤或皮肤软组织感染，包括未并发骨髓炎的糖尿病足部感染。④金黄色葡萄球菌（仅为甲氧西林敏感的菌株）或化脓链球菌引起的非复杂性皮肤或皮肤软组织感染。⑤由肺炎链球菌［包括对多药耐药的菌株(MDRSP)］、金黄色葡萄球菌（仅为甲氧西林敏感的菌株）所致的社区获得性肺炎及伴发的菌血症。

【注意事项】(1) 应 1 周进行全血细胞计数的检查，尤其是用药超过 2 周，或以前有过骨髓抑制病史，或合并使用能诱导发生骨髓抑制的其他药物，或患慢性感染既往或目前合并接受其他抗菌药物治疗的患者。(2) 可能发生假膜性结肠炎。(3) 可能发生乳酸性酸中毒。(4) 可能出现视力损害，应及时进行眼科检查。对于所有长期（≥ 3 个月）使用的患者，应当进行视觉功能监测。多数视神经病变可于停药后缓解，但周围神经病变并非如此。故应进行用药与潜在风险评价，以判断是否继续用药。(5) 用药期间应避免食用大量酪胺含量高的食物和饮料；避免服用含盐酸伪麻黄碱或盐酸苯丙醇胺的药物，5-羟色胺再摄取抑制药或其他抗抑郁药，可能呈现苯酮尿，因口服干混悬剂每 5 ml 含有 20 mg 苯丙氨酸。(6) 哺乳期妇女慎用。尚未在妊娠妇女中进行充分的、有对照的临床研究。只有潜在的益处超过对胎儿的潜在风险时，才建议妊娠妇女使用。(7) 不推荐利奈唑胺经验性用于儿童患者的中枢神经系统感染。(8) 肾功能不全患者慎用。

【禁忌证】对利奈唑胺或其制剂中的成分（枸橼酸钠、枸橼酸、葡萄糖，利奈唑胺口服干混悬剂中含苯丙氨酸）过敏的患者禁用。

【不良反应】(1) 常见失眠、头晕、头痛、腹泻、恶心、呕吐、便秘、皮疹、瘙痒、发热、口腔念珠菌病、阴道念珠菌病、真菌感染。(2) 用药时间过长（超过 28 日）时的不良反应有骨髓抑制（包括贫血、白细胞减少、各类血细胞减少和血小板减少）、周围神经病和视神经病（有的进展至失明）、乳酸性酸中毒。(3) 与 5-羟色胺类药（包括抗抑郁药，如选择性 5-羟色胺再摄取抑制药）合用时可能发生 5-

羟色胺综合征。

【用法与用量】口服或静脉滴注：滴注时间30～120分钟。(1) 复杂性皮肤或皮肤软组织感染、社区获得性肺炎及伴发的菌血症、院内获得性肺炎：①成人或12岁以上儿童：每12小时静脉滴注或口服600 mg，疗程10～14日。②儿童（新生儿至11岁）：按体重每8小时静脉注射或口服10 mg/kg，疗程10～14日。(2) 万古霉素耐药的屎肠球菌感染及伴发的菌血症：①成人或12岁以上儿童：每12小时静脉滴注或口服600 mg，疗程14～28日。②儿童（新生儿至11岁）：按体重每8小时静脉滴注或口服10 mg/kg，疗程14～28日。(3) 单纯性皮肤或皮肤软组织感染：①成人或12岁以上儿童：每12小时口服400 mg，青少年每12小时口服600 mg，疗程10～14日。②儿童：按体重，<5岁，每8小时10 mg/kg口服；5～11岁，每12小时10 mg/kg口服。疗程10～14日。(4) 甲氧西林耐药金黄色葡萄球菌(MTSA)感染：①成人，一次600 mg，每12小时1次。②儿童：按体重，新生儿，10 mg/kg，每8小时一次，疗程7日。出生7日以内的早产（<34孕周）患儿，初始剂量10 mg/kg，每12小时1次，当临床效果不佳时，应考虑按剂量10 mg/kg，每8小时给药。从静脉给药转换成口服给药时无需调整剂量。

【制剂与规格】利奈唑胺注射液：① 300 ml：0.6 g，② 100 ml：0.2 g。

利奈唑胺片：① 200 mg，② 600 mg。

利奈唑胺口服混悬液：5 ml：100 mg。

小檗碱[基(基)，保(甲)]

Berberine

【适应证】用于志贺菌、霍乱弧菌等敏感病原菌感染所致的胃肠炎、细菌性痢疾等肠道感染。

【注意事项】本品静脉注射后可发生严重溶血性贫血和循环障碍，严格禁止静脉给药。

【禁忌证】本品可引起严重溶血性贫血，对葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏儿童禁用。

【不良反应】口服后不良反应较少，偶见呕吐、恶心、皮疹、药物热，停药后可消失。静脉注射或滴注可致静脉炎、血管扩张、血压下降、心脏抑制等，严重时可发生阿斯综合征，甚至死亡。我国已经淘汰本品注射剂。

【用法与用量】口服：一次0.1～0.3 g，一日3次。

【制剂与规格】盐酸小檗碱：① 50 mg；② 100 mg。

鱼腥草素[保(甲)]

Houttuyfonate

【适应证】(1) 用于慢性支气管炎、小儿肺炎和其他呼吸道炎症性疾病。(2) 对宫颈炎、附件炎、银屑病有一定的疗效。

【注意事项】(1) 本药静脉输注时不宜与其他药物混合使用，并应避免快速输注。(2) 药物对妊娠及哺乳的影响，尚不明确。

【禁忌证】对本药有过敏史或过敏体质者应避免使用。

【不良反应】(1) 口服给药时有令人不快的鱼腥味，也偶见皮疹等过敏反应症状，但停药后可自行消退。(2) 静脉给药时有出现呼吸困难、过敏性休克的报道。

【用法与用量】成人常规剂量：(1) 口服：一次60～90mg，一日3次。(2) 肌内注射：一次8 mg，一日2次。(3) 静脉注射：同肌内注射。(4) 静脉滴注：一次8～16 mg，加入10%葡萄糖溶液中缓慢滴入。(5) 经阴道给药：鱼腥草素钠外用片，一次1片（含鱼腥草素钠20 mg），一日1～2次。清洁阴道后将药片放入阴道创面，用带线棉球固定。

【制剂与规格】鱼腥草素钠片：30 mg。

鱼腥草素钠外用片：0.5 g（含鱼腥草素钠20 mg）。

鱼腥草素钠注射液：2 ml：4 mg。

大蒜素[保(乙)]

Alltride (Garlicin)

【适应证】抗感染药。本品适用于深部真菌和细菌感染、防治急慢性菌痢和肠炎、百日咳、肺部和消化道的真菌感染、

白色念珠菌菌血症、隐球菌性脑膜炎和肺结核等。

【注意事项】因大蒜素对胃有刺激性且易被胃液破坏，故服用本品时不得咬破，应整粒吞服。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】口服：成人一次 40 mg，一日 4 次；儿童酌减或遵医嘱。静脉滴注：一次 90 ~ 150 mg，用 5% 或 10% 葡萄糖注射液 1 000 ml，稀释后缓慢滴注，4 ~ 5 小时滴完。

【制剂与规格】大蒜素胶囊：20 mg。

大蒜素注射液：2 ml ∶ 30 mg。

9.4 抗结核药

9.4.1 结核病化学治疗药的分类、评价及应用原则

结核病（tuberculosis）是感染结核分枝杆菌而导致的慢性传染病，可侵及全身各系统各脏器，其中，肺结核为最常见，是急需治疗控制的主要对象。

结核病的化学治疗是结核病治疗的最重要的基本手段，是控制结核病流行的最有效的措施。目前已有 10 余种高效和有效的抗结核药，2006 年 WHO 将其分为五大类。

第 1 类，即一线抗结核药，包括异烟肼(简称 H,下同)、利福平(R)(见 9.3.9)、利福喷汀（L）、吡嗪酰胺（Z）及乙胺丁醇（E）；第 2 类，即注射剂，包括链霉素、卡那霉素（K）、阿米卡星（A）及卷曲霉素（C）；第 3 类，即氟喹诺酮类，包括环丙沙星（C）、氧氟沙星（O）（见 9.3.14）、左氧氟沙星（V）（见 9.3.14）、莫西沙星（MO）、加替沙星（G）；第 4 类，即口服抑菌药，包括乙硫异烟胺（Eth）、丙硫异烟胺（Pth）、对氨基水杨酸钠（P）及环丝氨酸（Cs）；第 5 类，即疗效不肯定药物，包括氨苄西林克拉维酸复合制剂）、氯法齐明、克拉霉素及利奈唑胺。

对抗结核药的下列三项作用的评价：①早期杀菌活性，在抗结核药物中，异烟肼早期杀菌活性最强，其次为利福平、链霉素。②灭菌活性，在一线药物中，吡嗪酰胺、利福平灭菌活性最强。③预防耐药性，研究证明大量敏感菌群中同时常存有少量的基因突变的耐药菌，在单一药物治疗过程中，敏感菌群被杀灭，而耐药菌株就成为优势菌群，单一异烟肼治疗发生耐药菌株的概率为 $1/10^6$（10^{-6}），利福平为 $1/10^8$（10^{-8}），链霉素、乙胺丁醇为 $1/10^3$（10^{-3}）。因此，异烟肼、利福平预防伍用药物产生耐药性的作用最强，其次为乙胺丁醇。

结核分枝杆菌是一种“顽强”的致病菌，以富含脂质的细胞壁为其天然屏障，侵入人体后具有持留性、潜伏性、冬眠性及突变性等特点，使结核病在临床上成为慢性迁延、需较长程的联合化疗，即使当前已被公认的短程化疗也需 6 个月的疗程，否则易于复发，甚至发展为耐药结核病、耐多药结核病（MDR-TB）、乃至严重耐多药结核病（XDR-TB）、成为难治结核病。因此，结核病的治疗必须遵循“早期、联合、规律、全程、适量”的原则。

9.4.2 结核病化学治疗方案的确立及其注意事项

（1）基于各种抗结核药物在上述三大作用中的优势不同，又鉴于各种药物对结核杆菌的作用靶位不同，需要联合化学治疗以达到药物间协同或累加作用，发挥早期杀菌和灭菌活性，减少耐药性产生，以期提高疗效，减少治疗失败，减少复发，减少耐药结核病发生的保证。为了提高血药峰值浓度，异烟肼、利福平、利福喷汀、喹诺酮类药物宜顿服，其他药物根据患者耐受性而定(表 9-10)。一般建议,异烟肼、利福平、利福喷汀空腹顿服。

（2）结核病的化学治疗可分为 2 个阶段：①第 1 阶段为强化期，一般为 2 个月，常以异烟肼（H）、利福平或利福喷汀（R 或 L）、吡嗪酰胺（Z）3 种核心药物及乙胺丁醇（E）或链霉素（S）等 3 ~ 4 种药物联合，简称 2HRZE（S）方案。②第 2 阶段为持续期，一般为 4 个月，常联用异烟肼、利福平、乙胺丁醇 3 药，简称 4HRE 方案。全方案的简称为 2HRZE（S）/4HRE（见下文）。

（3）链霉素、异烟肼、利福平、乙胺丁醇具有不同程度的抗生素后效应（又称

表 9-10　抗结核药物的用法、剂量及主要不良反应

药品及其名称缩写	用法与用量					主要不良反应
	一日疗法			间歇疗法		
	成人一日剂量（g）		儿童 mg/kg	成人（g）		
	体重＜ 50 kg	体重≥ 50 kg		体重＜ 50 kg	体重≥ 50 kg	
异烟肼（INH，H）	0.3	0.3	10 ~ 15	0.5	0.6	肝毒性，末梢神经炎
利福平（RFP，R）	0.45	0.6	10 ~ 20	0.6	0.6	肝毒性，胃肠反应，过敏反应
利福喷汀（RFT，L）	—	—	—	0.45 一周 2 次	0.6 一周 1 ~ 2 次	同利福平
吡嗪酰胺（PZA，Z）	1.5	1.5	30 ~ 40	2.0	2.0	肝毒性，胃肠反应，血尿酸增高，关节痛
乙胺丁醇（EMB，E）	0.75	0.75 ~ 1.0	—	1.0	1.2	视力障碍，视野缩小
链霉素（SM，S）	0.75（肌内注射）	0.75	20 ~ 30	0.75	0.75	听力、前庭功能、肾功能障碍，过敏反应
阿米卡星（AMK，A）	0.4（肌内注射或静脉滴注）	0.4	—	0.4	0.4	同链霉素
卷曲霉素（CPM，C）	0.75（肌内注射或静脉滴注）	1.0	—	0.75	1.0	同链霉素。电解质紊乱
氧氟沙星（OFLX，O）	0.6(口服或静脉滴注)	0.6 ~ 0.8	—	—	—	头痛，失眠，关节痛，肌腱炎，胃肠反应，过敏反应，血象变化
左氧氟沙星（LVFX，V）	0.4(口服或静脉滴注)	0.4 ~ 0.5	—	—	—	同氧氟沙星
莫西沙星（MOFX，M）	0.4(口服或静脉滴注)	0.4	—	—	—	同氧氟沙星
加替沙星（GAFX，G）	0.4(口服或静脉滴注)	0.4	—	—	—	同氧氟沙星。糖代谢紊乱
对氨基水杨酸钠（PAS，P）	8.0（静脉滴注）	8.0	150 ~ 200	—	—	肝毒性，过敏反应，胃肠反应
帕司烟肼（Pasinzid，Pa）	0.9	0.9	20 ~ 40	—	—	肝毒性，胃肠反应，周围神经炎
丙硫异烟胺（TH，Pth）	0.6 ~ 0.75	0.75 ~ 1.0	—	—	—	胃肠反应，肝毒性，口感金属味

延缓生长期），可根据病情和减少不良反应，采用适当增加日剂量，一周 3 次或 2 次的间歇治疗。如 $H_3R_3E_3$ 方案，即一周 3 次服用异烟肼、利福平、乙胺丁醇。

（4）为了保证患者按规定方案，不中断地完成全程治疗，治疗管理也是保证化疗成功的重要因素之一。

（5）为了保证依从性和防止单药治疗，WHO 积极推荐采用含异烟肼、利福平、吡嗪酰胺和含异烟肼、利福平及含异烟肼、利福平、吡嗪酰胺、乙胺丁醇的固定剂量复合剂，国内也有相应的复合制剂和各种药物的板式组合药其组合和应用方法，见表 9-11。各复方制剂的不良反应、注意事项等可见各组分的相应资料。

（6）根据患者治疗史以及药物敏感试验，结核病的治疗方案有初治、复治、耐药结核病（即对一线抗结核药物中一种药物耐药）、耐多药结核病（即至少耐异烟肼、利福平）、严重耐多药结核病（即至少耐异烟肼、利福平外，还对一种注射药物及一种喹诺酮类药物耐药）等多种治疗方案。

（7）结核性脑膜炎及脑结核患者，为了保证局部达到有效的药物浓度，需选用血脑通透性佳或较佳的抗结核药物——异烟肼、吡嗪酰胺、丙硫异烟胺、喹诺酮类药及环丝氨酸等药物，异烟肼需增加剂量。

（8）联合化疗方案中的各种药物可能有各自的不良反应，联合用药可能增加不良反应发生的频率，因此，治疗过程中需注意肝、肾功能，血象，过敏反应等，必要时可加用保护肝功能的药物，或在方案组成及剂量用法上做相应的调整。

（9）有一些药品的药物学可参见相关内容，如氧氟沙星（见 9.3.14）、左氧氟沙星（见 9.3.14）、莫西沙星（见 9.3.14）、阿米卡星（见 9.3.4）、克拉霉素（见 9.3.6）。

9.4.3 结核病的化学治疗方案

下面列出临床常用的各种结核病的化学治疗方案。各方案的药品名称以英

表 9-11 抗结核药的固定复合制剂

药品	组分及其含量（片或胶囊）	剂量及口服方法
异福片（Isoniazid and Rifampicin Tablets）0.45 g	异烟肼 150 mg 利福平 300 mg	体重≥ 50 kg，一日 2 片
异福片（Isoniazid and Rifampicin Tablets）0.25 g	异烟肼 150 mg 利福平 100 mg	
异福胶囊（Isoniazid and Rifampicin Capsules）0.45 g	异烟肼 300 mg 利福平 150 mg	体重≥ 50 kg，一日 2 粒
异福胶囊（Isoniazid and Rifampicin Capsules）0.25 g	异烟肼 150 mg 利福平 100 mg	
异福胶囊（Isoniazid and Rifampicin Capsules）0.225 g	异烟肼 150 mg 利福平 75 mg	
异福酰胺片（Isoniazid，Rifampicin and Pyrazinamide Tablets）0.45 g	异烟肼 80 mg 利福平 120 mg 吡嗪酰胺 250 mg	体重 40 ~ 49 kg，一日 4 片 体重≥ 50 kg，一日 5 片
异福酰胺胶囊（Isoniazid，Rifam-picin and Pyrazinamide Capsules）0.45 g	异烟肼 80 mg 利福平 120 mg 吡嗪酰胺 250 mg	体重 40 ~ 49 kg，一日 4 粒 体重≥ 50 kg，一日 5 粒
异福酰胺胶囊（Isoniazid，Rifam-picin and Pyrazinamide Capsules）0.225 g	异烟肼 40 mg 利福平 60 mg 吡嗪酰胺 125 mg	

* 国内尚有含异烟肼、利福平、吡嗪酰胺、乙胺丁醇及异烟肼、利福平、乙胺丁醇的板式组合药

文字母表示（见9.4.1）。“/”前者为强化期用药；“/”后者为持续期用药。其中的阿拉伯数字表示疗程的“月”数；英文字母后下标的阿拉伯数字表示一周用药次数（无下标的表示一日1次）。如“$2HRZE/4H_3R_3E_3$”表示为强化期服用异烟肼(H)一日1次，利福平(R)一日1次，吡嗪酰胺（Z）一日1次和乙胺丁醇（E）一日1次；疗程2个月；持续期服用异烟肼（H）一周3次，利福平（R）一周3次和乙胺丁醇（E）一周3次；疗程4个月。药品的用量，见表9-10。

9.4.3.1 肺结核的化学治疗方案

(1) 初治菌阳肺结核

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZE/4HRE。

◆ 次选：$2HL_2ZE/4HL_2E$；$2HRZE/4H_3R_3E_3$；9HRE。

◆ 说明：初治指既往从未治疗或规律治疗<1个月。菌阳：包括痰涂片（+）及（或）培养（+）。

(2) 初治菌阴肺结核

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZE/4HR。

◆ 次选：2HRZ/4HR，$2H_3R_3Z_3/4H_3R_3$。

◆ 说明：无细菌学证实的（即痰涂片及培养均为阴性）活动性肺结核。

(3) 复治肺结核（初次）

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZES/6HRE。

◆ 次选：$2H_3R_3Z_3E_3S_3/5H_3R_3E_3$；2HRZES/5HRE。

◆ 说明：复治指接受过>1个月的化学治疗或初治失败或治疗后初次复发。

(4) 复治肺结核（反复）

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌（可能已对部分抗结核药物耐药）。

◆ 首选：2HRZES/6HRE。

◆ 次选：根据药物敏感试验结果及既往用药史选用含3～4种敏感药物的化疗方案（包括阿米卡星，喹诺酮类等）。

◆ 说明：需行药物敏感试验指导用药。

(5) 耐多药肺结核

◆ 说明：需行药物敏感试验指导用药。

◆ ①可能病菌：至少耐异烟肼、利福平或以上的结核分枝杆菌。

◆ 首选：3～6个月强化期，含S（或A、C）ZEV（或M）Pth（或P）及18个月继续期含ZEVPth（或P）。

◆ 次选：根据药敏结果、既往用药史，患者的肝肾功能等进行调整。

◆ ②可能病菌：耐HR者。

◆ 首选：6ZESVPTH（或P）/18ZEVPth（或P）。

◆ ③可能病菌：耐HRS者。

◆ 首选：6ZEA（或C）VPth（或P）/18ZEVPth（或P）。

◆ ④可能病菌：耐HRE者。

◆ 首选：6ZCSSVPth（或P）/18CS（或P）VPt（或P）。

◆ ⑤可能病菌：耐HRES者。

◆ 首选：6ZCS（或P）A（或C）VPth/18ZCSVPthP。

9.4.3.2 肺外结核治疗方案

(1) 急性血行播散性肺结核

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2-3HRZES/9-10HRE。

◆ 次选：2HRZE（或S）/10HRE。

◆ 说明：需注意有无并发多发性浆液膜炎及脑、肝、脾等全身结核病。

(2) 结核性胸膜炎、结核性腹膜炎、结核性心包炎

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZE（或S)）/10HRE。

◆ 次选：2HRZE（或S）/10HRE。

◆ 说明：应积极抽液。高热、胸液增长迅速、难以控制者可并用糖皮质激素。中、多量心包积液时应穿刺排液，并用糖皮质激素减少心包粘连、增厚。

(3) 结核性脑膜炎

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2-3HRZE（或S）/9-12-15HRZ（或E）。

◆ 次选：可采用Pth代替Z、加用喹诺酮类药物，3HRPthO（或V）S/12-15HRPthO（或V）。

◆ 说明：H日剂量可增至0.6～0.75g，Z宜较长期服用，总疗程12～18个月或以上。治疗早期并用糖皮质激素2～3个

月或以上。有椎管阻塞、脑脊液蛋白质≥300 mg/dl者可并用鞘内注入H（0.1/次及地塞米松一次3～5 mg）。颅压高者需辅以甘露醇等脱水治疗。注意有无并发脑结核，可借头颅MRI诊断。

（4）肝、脾结核

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZE（或S）/10HRE。

◆ 次选：2HRZES/10HRE；2HRO（或V）ES/10HRO（或V）。

◆ 说明：肝结核病变广泛时，可伴有肝功能损害，除以喹诺酮类药物代替吡嗪酰胺后还需密切注意肝功能动态变化。

（5）肾结核、生殖系结核（包括盆腔结核）

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2-3HRZES（或A）/9-10HRE。

◆ 次选：2HRZEV/10HRV。

◆ 说明：Z、E、S（或A），喹诺酮类药物剂量需根据肾功能及肾脏病变程度进行调整，即一周2～3次间歇用药，必要时在化学治疗控制后行手术治疗。盆腔积液时需穿刺排液，必要时在化学治疗控制后行手术治疗。

（6）肺门纵隔淋巴结结核、浅表淋巴结结核

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZE（或S）/10HRE。

◆ 次选：2HRZEV/10HRV。

◆ 说明：肺门纵隔淋巴结结核，据病情疗程需延长，并发支气管淋巴瘘或支气管结核压迫可辅用支气管镜下给药或雾化吸入。浅表淋巴结结核，需辅以如穿刺、排脓、清创局部治疗乃至手术治疗。

（7）气管、支气管结核、脊柱结核及其他部位骨关节结核

◆ 可能病菌：结核分枝杆菌。

◆ 首选：2HRZE（或S）/10HRE。

◆ 次选：2HRZES/10HRE；2HRZEV/10HRE。

◆ 说明：气管、支气管结核：必要时可辅以局部治疗，防止气管支气管狭窄，乃至肺不张。脊柱结核及其他部位骨关节结核：有时需辅以局部治疗包括清创、病灶清除、椎管减压等。

异烟肼[基(基)、保(甲)]

Isoniazid

【适应证】与其他抗结核药联合，用于各种类型结核病及部分非结核分枝杆菌病。

【注意事项】（1）精神病、癫痫、肝功能损害及严重肾功能损害者应慎用本品或剂量酌减。（2）异烟肼与乙硫异烟胺、吡嗪酰胺、烟酸或其他化学结构有关药物存在交叉过敏。（3）大剂量应用时，可使维生素B_6大量随尿排出，抑制脑内谷氨酸脱羧变成γ-氨酪酸而导致惊厥，也可引起周围神经系统的多发性病变。因此，成人一日同时口服维生素B_6 50～100 mg有助于防止或减轻周围神经炎及（或）维生素B_6缺乏症状。如出现轻度手脚发麻、头晕，可服用维生素B_1或维生素B_6，若重度者或有呕血现象，应立即停药。（4）肾功能减退但血肌酐值＜6 mg/100 ml者，异烟肼的用量无须减少。如肾功能减退严重或患者系慢乙酰化者则需减量，以异烟肼服用后24小时的血药浓度不超过1 mg/L为宜。在无尿患者，异烟肼的剂量可减为常用量的1/2。（5）肝功能减退者剂量应酌减。（6）用药前、疗程中应定期检查肝功能，包括血清胆红素、AST、ALT，疗程中密切注意有无肝炎的前驱症状，一旦出现肝毒性的症状及体征时应立即停药，必须待肝炎的症状、体征完全消失后方可重新用药，此时必须从小剂量开始，逐步增加剂量，如有任何肝毒性表现应即停药。（7）如疗程中出现视神经炎症状，需立即进行眼部检查，并定期复查。（8）慢乙酰化患者较易产生不良反应，故宜用较低剂量。（9）异烟肼可透过胎盘屏障，导致胎儿血药浓度高于母体血药浓度。孕妇应避免应用，如确有指征应用时，必须充分权衡利弊。（10）异烟肼在乳汁中浓度可达12 mg/L，与血药浓度相近，如哺乳期间充分权衡利弊后决定用药，则宜停止哺乳。（11）新生儿肝脏乙酰化能力较差，以致消除半衰期延长，新生儿用药时应密切观察不良反应。（12）50岁以上患者用药引起肝炎的发生率较高，治疗时更需密切注意肝功能的变化，必要时减少剂量或同时酌情使用保护肝功能的制剂。

【禁忌证】对本品过敏的患者禁用。

【不良反应】常用剂量的不良反应发生率较低。剂量加大至6 mg/kg时，不良反应发生率显著增加，主要为周围神经炎及肝脏毒性，加用维生素 B_6 虽可减少毒性反应，但也可影响疗效。(1) 肝脏：可引起轻度一过性肝损害如AST及ALT升高及黄疸等，发生率为10% ~ 20%。肝脏毒性与本品的代谢产物乙酰肼有关，快乙酰化者乙酰肼在肝脏积聚增多，故易引起肝损害。服药期间饮酒可使肝损害增加。毒性反应表现为食欲不佳、异常乏力或软弱、恶心或呕吐（肝毒性的前驱症状）及深色尿、眼或皮肤黄染（肝毒性）。(2) 神经系统：周围神经炎多见于慢乙酰化者，并与剂量有明显关系。较多患者表现为步态不稳、麻木针刺感、烧灼感或手脚疼痛。此种反应在铅中毒、动脉硬化、甲状腺功能亢进、糖尿病、酒精中毒、营养不良及孕妇等较易发生。其他毒性反应如兴奋、欣快感、失眠、丧失自主力、中毒性脑病或中毒性精神病则均属少见，视神经炎及萎缩等严重毒性反应偶有报道。(3) 变态反应：包括发热、多形性皮疹、淋巴结病、脉管炎等。一旦发生，应立即停药，如需再用，应从小剂量开始，逐渐增加剂量。(4) 血液系统：可有粒细胞减少、嗜酸性粒细胞增多、血小板减少、高铁血红蛋白血症等。(5) 其他：口干、维生素 B_6 缺乏症、高血糖症、代谢性酸中毒、内分泌功能障碍等偶有报道。

【用法与用量】(1) 口服：①成人：预防，一日0.3 g，顿服；治疗，成人与其他抗结核药合用，按体重一日口服5 mg/kg，最高0.3 g；或一日15 mg/kg，最高900 mg，一周服用2～3次。②儿童：预防。一日按体重10 mg/kg，最高0.3 g，顿服。治疗，按体重一日10～20 mg/kg，最高0.3 g，顿服。某些严重结核病（如结核性脑膜炎），一日按体重可高达30 mg/kg（最高500 mg），但要注意肝功能损害和周围神经炎的发生。(2) 肌内注射、静脉注射或静脉滴注：极少肌内注射。一般在强化期或对于重症或不能口服用药的患者可用静脉滴注的方法，用0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液稀释后使用。①成人：常用量，一日0.3 ~ 0.4 g；或5 ~ 10 mg/kg；急性粟粒型肺结核或结核性脑膜炎，一日10 ~ 15 mg/kg，最高0.9 g。间歇疗法时，一次0.6 ~ 0.8 g，一周应用2 ~ 3次。②儿童：一日按体重10 ~ 15 mg/kg，最高0.3 g。(3) 局部用药：①雾化吸入，一次0.1 ~ 0.2 g，一日2次。②局部注射（胸膜腔、腹腔或椎管内），一次50 ~ 200 mg。

【制剂与规格】异烟肼片：① 50 mg；② 100 mg；③ 300 mg。

异烟肼注射液：① 2 ml : 50 mg；② 2 ml : 100 mg。

异福片（胶囊）：0.25 g。

异福酰胺片（胶囊）：0.45 g。

异烟肼／利福平片（卫非宁）：用于结核病的治疗。①利福平150 mg，异烟肼75 mg；体重＜50 kg者，一日3片。②利福平300 mg，异烟肼150 mg。成人，一日2片。

乙胺丁醇[基(基)，保(甲)]

Ethambutol

【适应证】(1) 联合治疗结核杆菌所致的肺结核。(2) 结核性脑膜炎及非典型分枝杆菌感染的治疗。

【注意事项】(1) 痛风、视神经炎、肾功能减退慎用。(2) 治疗期间应检查：①眼部，视野、视力、红绿鉴别力等，在用药前、疗程中一日检查1次，尤其是疗程长，一日剂量超过15 mg/kg的患者。②乙胺丁醇可使血清尿酸浓度增高，引起痛风发作。应定期测定。(3) 可与食物同服，一日剂量宜一次顿服。(4) 单用时可迅速产生耐药性，必须与其他抗结核药联合应用。(5) 剂量应根据患者体重计算。(6) 肾功能减退或老年患者应用时需减量。(7) 可透过胎盘屏障，胎儿血药浓度约为母亲血药浓度的30%。孕妇应慎用。(8) 可在乳汁中分布，哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、已知视神经炎患者、乙醇中毒者及年龄＜13岁者禁用。

【不良反应】(1) 常见视物模糊、眼痛、红绿色盲或视力减退、视野缩小（视神经炎一日按体重剂量25 mg/kg以上

时易发生）。视力变化可为单侧或双侧。(2) 少见畏寒、关节肿痛（趾、踝、膝关节）、病变关节表面皮肤发热发紧感（急性痛风、高尿酸血症）。(3) 罕见皮疹、发热、关节痛等过敏反应；或麻木，针刺感、烧灼痛或手足软弱无力（周围神经炎）。

【用法与用量】口服：成人及 13 岁以上儿童，与其他抗结核药合用。①结核初治，按体重 15 mg/kg，一日 1 次，顿服；或一次 25 ~ 30 mg/kg，最高 2.5 g，一周 3 次；或 50 mg/kg，最高 2.5 g，一周 2 次。②结核复治，按体重 25 mg/kg，一日 1 次顿服，连续 60 日，继以按体重 15 mg/kg，一日 1 次，顿服。③非典型分枝杆菌感染，一日 15 ~ 25 mg/kg，一次顿服。

【制剂与规格】盐酸乙胺丁醇片：0.25 g。

盐酸乙胺丁醇胶囊：0.25 g。

吡嗪酰胺[基(基)，保(甲)]

Pyrazinamide

【适应证】联合用于治疗结核病。

【注意事项】(1) 交叉过敏，对乙硫异烟胺、异烟肼、烟酸或其他化学结构相似的药物过敏患者可能对吡嗪酰胺也过敏。(2) 对诊断的干扰：可与硝基氰化钠作用产生红棕色，影响尿酮测定结果；可使 AST 及 ALT、血尿酸浓度测定值增高。(3) 糖尿病、痛风或严重肝功能减退者慎用。(4) 使血尿酸增高，可引起急性痛风发作，须定时测定。(5) 孕妇结核病患者可先用异烟肼、利福平和乙胺丁醇治疗 9 个月，如对上述药物中任一种耐药而对吡嗪酰胺可能敏感者可考虑采用。

【禁忌证】有过敏史者及儿童禁用。

【不良反应】常见肝损害、关节痛；偶见过敏反应。

【用法与用量】口服：成人，与其他抗结核药联合。一日 15 ~ 30 mg/kg 顿服，最高一日 2 g；或一次 50 ~ 70 mg/kg，一周 2 ~ 3 次；一日服用者最高一次 3 g，一周服 2 次者最高一次 4 g。亦可采用间歇给药法，一周用药 2 次，一次 50 mg/kg。

【制剂与规格】吡嗪酰胺片：① 0.25 g；② 0.5 g。

吡嗪酰胺胶囊：0.25 g。

链霉素 用于结核病。肌内注射：一次 0.75 g，一日 1 次；如采用间歇疗法，即一周给药 2 ~ 3 次，一次 1 g；老年患者肌内注射，0.5 ~ 0.75 g，一日 1 次。(其他见 9.3.4)

利福喷汀[保(甲)]

Rifapentine

【适应证】(1) 联合用于各种结核病的初治与复治，但不宜用于结核性脑膜炎。(2) 医务人员直接观察下的短程化疗。(3) 非结核性分枝杆菌感染。(4) 联合用于麻风治疗。

【注意事项】(1) 与其他利福霉素有交叉过敏性。(2) 酒精中毒、肝功能损害者慎用。(3) 服用后引起白细胞和血小板减少时，应避免进行拔牙等手术，并注意口腔卫生，剔牙需谨慎，直至血象恢复正常。(4) 应用过程中，应经常检查血象和肝功能的变化情况。(5) 如曾间歇服用利福平因产生循环抗体而发生变态反应，如血压下降或休克、急性溶血贫血、血小板减少或急性间质性肾小管肾炎者，均不宜再用。(6) 应在空腹时（餐前 1 小时）用水送服；服利福平出现胃肠道刺激症状的患者可改服利福喷汀。(7) 单独用于治疗结核病可能迅速产生细菌耐药性，必须与其他抗结核药合用。(8) 患者服用后，大小便、唾液、痰液、泪液等可呈橙红色。(9) 哺乳期妇女用药经权衡利弊后决定用药，应暂停哺乳。(10) 老年患者肝功能有所减退，用药量应酌减。(11) 5 岁以下小儿应用的安全性尚未确定。

【禁忌证】对本品或利福霉素类抗菌药过敏者、肝功能严重不全、胆道阻塞者和孕妇。

【不良反应】(1) 少数病例可出现白细胞、血小板减少；AST 及 ALT 升高；皮疹、头晕、失眠等。(2) 少见胃肠道反应。(3) 如果出现流感症候群、免疫性血小板降低，或过敏性休克样反应须及时停药。

【用法与用量】口服：成人抗结核，一次 0.6 g（体重 < 55 kg 者应酌减），一日 1 次，空腹时（餐前 1 小时）用水送

服；一周服药1～2次。需与其他抗结核药联合应用，肺结核初始患者其疗程一般为6～9个月。

【制剂与规格】利福喷汀胶囊：①0.1g；②0.15g；③0.2g；④0.3g。

利福布汀[保(乙)]

Rifabutin

【适应证】用于艾滋病患者鸟分枝杆菌感染综合征，肺炎，慢性耐药性肺结核。

【注意事项】(1) 妊娠初始3个月内者应避免使用；妊娠3个月以上的患者有明确指征使用时，应充分权衡利弊后决定是否采用。(2) 肝功能不全、胆管梗阻、慢性酒精中毒患者应适当减量。(3) 用药期间，应定期复查肝功能、血常规。(4) 结核病患者应避免用大剂量间歇用药方案。中性粒细胞减少或血小板减少患者、肌炎或眼葡萄膜炎患者应慎用；定期进行血液学检查；定期观察是否出现肌炎或眼葡萄膜炎的相关症状或征兆。

【禁忌证】对利福布汀或其他利福霉素类药过敏者、用药后出现过血小板减少性紫癜的患者。

【不良反应】常见皮疹、胃肠道反应、嗜中性粒细胞减少症。

【用法与用量】口服：①鸟分枝杆菌感染，一次0.3g，一日1次，如有恶心，呕吐等胃肠道不适者，可改为一次0.15g，一日2次，进食同时服药可减轻胃肠道反应。②结核，一次0.15～0.3g，一日1次。③严重肾功能不全者（肌酐清除率每分钟＜30ml），剂量减半。

【制剂与规格】利福布汀胶囊：0.15g。

对氨基水杨酸钠[基(基)，保(甲)]

Sodium Aminosalicylate

【适应证】联合治疗结核分枝杆菌所致的肺及肺外结核病。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应：对其他水杨酸类包括水杨酸甲酯（冬青油）或其他含对氨基苯基团（如某些磺胺药和染料）过敏的患者本品亦可呈过敏。(2) 对诊断的干扰：使硫酸铜法测定尿糖出现假阳性；使尿液中尿胆原测定呈假阳性反应（氨基水杨酸类与Ehrlich试剂发生反应，产生橘红色浑浊或黄色，某些根据上述原理做成的市售试验纸条的结果也可受影响）；使ALT和AST的正常值增高。(3) 充血性心力衰竭、胃溃疡、葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G-6-PD）缺乏症、严重肝或肾功能损害患者慎用。(4) 孕妇和哺乳期妇女须权衡利弊后使用。(5) 儿童严格按用法、用量服用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见食欲缺乏、恶心、呕吐、腹痛、腹泻；过敏反应有瘙痒、皮疹、药物热、哮喘、嗜酸性粒细胞增多；少见胃溃疡及出血、血尿、蛋白尿、肝功损害及粒细胞减少。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次2～3g，一日4次。②儿童，按体重一日0.2～0.3g/kg，分3～4次服。一日剂量不超过12g。(2) 静脉滴注：①成人，一日4～12g，临用前加注射用水适量使溶解后再用5%葡萄糖注射液500ml稀释，2～3小时滴完。②儿童，一日0.2～0.3g/kg。

【制剂与规格】对氨基水杨酸钠肠溶片：0.5g。

对氨基水杨酸钠片：0.5g。

注射用对氨基水杨酸钠：①2g；②4g。

帕司烟肼[保(乙)]

Pasiniazid

【适应证】(1) 联合用于治疗各型肺结核、支气管内膜结核及肺外结核。(2) 与结核病相关手术的保护药。(3) 预防长期或大剂量皮质激素、免疫抑制治疗时的结核感染或复发。

【注意事项】(1) 至少应连续服用3个月，如无不良反应，中途不宜停药，经临床确诊痊愈后方可停药。(2) 孕妇、肝肾功能不良者和有精神病史、癫痫病史及脑外伤史者慎用。(3) 用药期间应定期进行肝功能检查。少数患者在用药的前2个月可出现一过性氨基转移酶升高。在保护肝功能治疗下继续用药，ALT及AST可恢复正常。若继续升高，则应停药。(4) 如疗程中出现视神经炎症状，需立即进行眼部检查，并定期复查。(5) 同服维

生素 B_6 可防治周围神经炎等神经系统的不良反应。(6) 抗酸药，尤其是氢氧化铝，可抑制本品吸收，不宜同服。(7) 本品可加强香豆素类抗凝血药、某些抗癫痫药、降压药、抗胆碱药、三环抗抑郁药的作用，合用时需注意。(8) 孕妇及哺乳期妇女用药慎用。

【禁忌证】精神病、癫痫患者和严重肝功能障碍患者禁用。

【不良反应】偶见头晕、头痛、失眠、发热、皮疹、恶心、乏力、黄疸、周围神经炎、视神经炎及血细胞减少等不良反应发生。

【用法与用量】口服：(1) 治疗：与其他抗结核药合用。①成人一日按体重 10～20 mg/kg，顿服。②儿童视个别需要可增至一日按体重 20～40 mg/kg，顿服。(2) 预防：一日按体重 10～15 mg/kg，顿服。

卷曲霉素[保(乙)]

Capreomycin

【适应证】用于经一线抗结核药（如链霉素、异烟肼、利福平和乙胺丁醇）治疗失败者，或对上述药中的一种或数种产生毒性作用或细菌耐药时，可作为联合用药之一。

【注意事项】(1) 听力减退、重症肌无力、帕金森病、肾功能不全者慎用。(2) 用药期间应注意检查：①听力测定一周 1～2 次，最好做电测听检查，1 个月 1 次。②定期做前庭功能及肾功能测定，尤其是肾功能减退或第Ⅷ对脑神经病变患者，一周 1～2 次，如尿素氮 30 mg/100 ml 以上需减量或停药。③肝功能测定，尤其与其他肝毒性抗结核药合用时。④血钾浓度测定：用药前、治疗中每月测定一次。(3) 对诊断的干扰：酚磺酞及磺溴酞钠排泄试验的结果降低；血液尿素氮及非蛋白氮的测定值可能增高。(4) 失水患者，由于血药浓度增高，可能增加毒性反应。(5) 卷曲霉素单用时细菌可迅速产生耐药，故只能与其他抗菌药联合用于结核病的治疗。卷曲霉素与卡那霉素有交叉耐药性，但与其他抗结核药无交叉耐药性。(6) 肾功能减退者按肌酐清除率调整剂量：≥ 110 ml 者，按正常人用量；每分钟 100 ml 者，一日 1 次，12.7 mg/kg；每分钟 80 ml 者，一日 1 次，10.4 mg/kg；每分钟 60 ml 者，一日 1 次，8.2 mg/kg；每分钟 50 ml 者，一日 7 mg/kg，或每 48 小时 14 mg/kg；每分钟 40 ml 者，一日 5.9 mg/kg，或每 48 小时 11.7 mg/kg；每分钟 30 ml 者，一日 4.7 mg/kg，或每 48 小时 9.5 mg/kg；每分钟 20 ml 者，一日 3.6 mg/kg，或每 48 小时 7.2 mg/kg；每分钟 10 ml 者，一日 2.4 mg/kg，或每 48 小时 4.9 mg/kg；每分钟 0 ml 者，一日 1.3 mg/kg，或每 48 小时 2.6 mg/kg 或每 72 小时 3.9 mg/kg。(7) 用药 2～3 周后如病情好转，仍需继续用完整个疗程。(8) 注射时需作深部肌内注射，注射过浅可加重疼痛并发生无菌性脓肿。(9) 不推荐在儿童患者中使用。(10) 老年人肾功能呈生理性减退，需根据肾功能调整剂量。

【禁忌证】对卷曲霉素过敏者、孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 具显著肾毒性，表现为肌酐、尿素氮升高、肌酐清除率减低、蛋白尿、管型尿等，用药期间需监测肾功能和尿常规。(2) 对第Ⅷ对脑神经有损害，一般在用药至 2～4 个月时可出现前庭功能损害，而听觉损害则较少。(3) 有一定神经肌肉阻滞作用。(4) 皮疹、瘙痒、皮肤红肿等过敏反应。较多发生的反应有低钾血症、肾毒性，较少发生者为过敏反应，耳毒性、耳 - 前庭毒性、神经肌肉阻断作用、低钙血症。

【用法与用量】深部肌内注射：临用时，加 0.9% 氯化钠注射液使其溶解后使用。成人一日 1g，持续 60～120 日，而后一周 2～3 次，一次 1 g；现多主张一次 0.75 g，一日 1 次。

【制剂与规格】注射用硫酸卷曲霉素：① 0.5 g (50 万 U)；② 0.75 g (75 万 U)。

丙硫异烟胺[保(乙)]

Protionamide

【适应证】与其他抗结核药联合用于结核病经一线药（如链霉素、异烟肼、利福平和乙胺丁醇）治疗无效者。

【注意事项】(1) 交叉过敏，患者对异烟肼、吡嗪酰胺、烟酸或其他化学结构相近的药物过敏者可能对丙硫异烟胺过敏。(2) 糖尿病、严重肝功能减退患者慎用。(3) 治疗期间须进行：①用药前和疗程中每2～4周测定丙氨酸氨基转移酶、天冬氨酸氨基转移酶，但上述试验值增高不一定预示发生临床肝炎，并可能在继续治疗过程中恢复。②眼部检查，如治疗过程中出现视力减退或其他视神经炎症状时应立即进行眼部检查，并定期复查。(4) 12岁以下儿童不宜服用。

【禁忌证】对丙硫异烟胺过敏者及孕妇禁用。

【不良反应】(1) 发生率较高者有：精神忧郁（中枢神经系统毒性）。(2) 发生率较少者有：步态不稳或麻木、针刺感、烧灼感、手足疼痛（周围神经炎）、精神错乱或其他精神改变（中枢神经系统毒性）、眼或皮肤黄染（黄疸、肝炎）。(3) 发生率极少者有：视物模糊或视力减退、合并或不合并眼痛（视神经炎）、月经失调或怕冷、性欲减退（男子）、皮肤干而粗糙、甲状腺功能减退、关节疼痛、僵直肿胀。(4) 如持续发生以下情况者应予注意：腹泻、唾液增多、流口水、食欲减退、口中金属味、恶心、口痛、胃痛、胃部不适、呕吐（胃肠道紊乱、中枢神经系统毒性）、眩晕（包括从卧位或坐位起身时）、嗜睡、软弱（中枢神经系统毒性）。

【用法与用量】口服：(1) 成人常用量一次250 mg，一日2～3次。(2) 小儿常用量一次按体重口服4～5 mg/kg，一日3次。

【制剂与规格】丙硫异烟胺肠溶片：0.1 g。

9.5 抗麻风药

麻风病（lepra）的病原菌为麻风分枝杆菌，可分为5型。以往由于可致畸残和难以治愈，社会偏见十分严重。自1998年WHO研究组推荐麻风联合化疗（MDT）方案，可减少耐药性的发生和缩短疗程，其后麻风病的治疗有了显著进步，使该病可以治愈。其方案如下：

多菌型麻风病（包括瘤型麻风、偏瘤型界线类麻风和中间界线类麻风）：利福平600 mg，1月1次，在督导下服用；氨苯砜一日100 mg。氯法齐明300 mg，1月1次，在督导下服用；氨苯砜一日50 mg，疗程24个月。

少菌型麻风病（包括偏结核样型界线类麻风、结核样型麻风和未定型麻风）：利福平一次600 mg，1个月1次，在督导下服用；氨苯砜一日100 mg，疗程6个月。

氨苯砜 [基(基)，保(甲)]

Dapsone

【适应证】(1) 联合治疗由麻风分枝杆菌引起的各种类型麻风和疱疹样皮炎。(2) 脓疱性皮肤病、类天疱疮、坏死性脓皮病、复发性多软骨炎、环形肉芽肿、系统性红斑狼疮的某些皮肤病变、放线菌性足分枝菌病、聚合性痤疮、银屑病、带状疱疹。(3) 与甲氧苄啶联合治疗卡氏肺孢子虫感染。(4) 与乙胺嘧啶联合预防氯喹耐药性疟疾；与乙胺嘧啶和氯喹三者联合预防间日疟。

【注意事项】(1) 下列情况应慎用：严重贫血、葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G-6-PD）缺乏、变性血红蛋白还原酶缺乏症、肝、肾功能减退、胃与十二指肠溃疡及有精神病史者。(2) 交叉过敏：砜类药物之间存在交叉过敏现象。此外，对磺胺类、呋塞米、噻嗪类利尿药、磺酰脲类以及碳酸酐酶抑制药过敏的患者亦可能对氨苯砜发生过敏。(3) 随访检查：①血常规计数，用药前和治疗第一个月中一周1次，以后每月1次，连续6个月，以后每半年1次。②葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G-6-PD）测定，如为G-6-PD缺乏者则本品应慎用，应用时需减量。③治疗中患者发生食欲减退、恶心或呕吐时应做肝功能测定，如有肝脏损害，应停用本品。④肾功能减退者在治疗中应定期测定肾功能，并适当调整剂量，如肌酐清除率低于每分钟4 ml时需测定血药浓度，无尿患者应停用。(4) 鉴于本品耐药性日渐增多，不宜单独应用，应与利福平、氯法齐明、乙硫异烟胺、丙硫异烟胺、氧氟沙星、米诺环素、克拉霉素等联合应用。(5) 皮损查菌阴性者疗程

6个月；阳性者至少2年或用药至细菌转阴。对未定型和结核样麻风的治疗需持续3年，二型麻风需2～10年，瘤型麻风需终身服药。(6) 快乙酰化型患者本品的血药浓度可能很低，需调整剂量。慢乙酰化型患者本品的血药浓度可能较高，亦需调整剂量。(7) 用药过程中如出现新的或中毒性皮肤反应，应迅速停用。但出现麻风反应状态时不需停药。(8) 治疗中如出现严重"可逆性"反应(Ⅰ型)或神经炎时，应合用大剂量肾上腺皮质激素。(9) 治疗疱疹样皮炎时，应服用无麸质饮食，连续6个月，氨苯砜的剂量可减少50%或停用。(10) 氨苯砜可在乳汁中达有效浓度，对新生儿具预防作用。但砜类药物在G-6-PD缺乏的新生儿中可能引起溶血性贫血。孕妇及哺乳期妇女用药前应充分权衡利弊后决定是否采用，如确有应用指征者应在严密观察下应用。(11) 儿童用量酌减，一般对儿童的生长发育无明显影响。(12) 老年患者肝肾功能有所减退，用药量应酌减。

【禁忌证】对氨苯砜及磺胺类药过敏者、严重肝功能损害和精神障碍者禁用。

【不良反应】(1) 常见背痛、腿痛，胃痛，食欲减退；皮肤苍白、发热、溶血性贫血、皮疹、异常乏力、软弱、变性血红蛋白血症。少见皮肤瘙痒、剥脱性皮炎、精神紊乱、周围神经炎、咽痛、粒细胞减低或缺乏、砜类综合征或肝脏损害等。(2) 下列症状如持续存在需引起注意：眩晕、头痛、恶心、呕吐。

【用法与用量】口服：麻风病时多与其他抗麻风药合用。(1) 成人：①麻风：一次50～100 mg，一日1次；或按体重一次0.9～1.4 mg/kg，一日1次，最高剂量一日200 mg。开始可一日口服12.5～25 mg，以后逐渐加量到一日100 mg。②治疗疱疹样皮炎：起始一日50 mg，如症状未完全抑制，一日剂量可增加至300 mg，最高剂量一日500mg，待病情控制后减至最低有效维持量。(2) 儿童：①麻风：按体重一次0.9～1.4 mg/kg，一日1次。②治疗疱疹样皮炎：开始按体重一次2 mg/kg，一日1次，如症状未完全控制，可逐渐增加剂量，待病情控制后减至最小有效量。由于氨苯砜有蓄积作用，故每服药6日停药1日，每服药10周停药2周。(3) 预防疟疾，氨苯砜100 mg与乙胺嘧啶12.5 mg联合，1次顿服，7日服药1次。

【制剂与规格】氨苯砜片：① 50 mg；② 100 mg。

氨苯砜凝胶：5%。

醋氨苯砜[保(甲)]

Acedapsone

【适应证】用于麻风病的预防及不能口服砜类药物者。

【注意事项】(1) 下列情况应慎用：严重贫血、G-6-PD缺乏、变性血红蛋白还原酶缺乏症、肝、肾功能减退、胃和十二指肠溃疡病及有精神病史者。(2) 交叉过敏：砜类药物之间存在交叉过敏现象。此外，对磺胺类、呋塞米类、噻嗪类、磺酰脲类以及碳酸酐酶抑制药过敏的患者亦可能对醋氨苯砜发生过敏。(3) 为了防止长期单用醋氨苯砜导致细菌产生耐药性，可在用药期间加服氨苯砜一次0.1～0.15 g，一周2次。(4) 初次注射局部有较强的疼痛感，连续应用可望减轻。肌内注射后应予热敷，促使药物吸收。(5) 用前振摇均匀，用粗针头吸出，注入臀肌。(6) 孕妇及哺乳期妇女用药前应由医师充分权衡利弊后决定是否采用，如确有应用指征者应在严密观察下应用。(7) 儿童用量酌减，一般对儿童的生长发育无明显影响。(8) 老年患者肝肾功能有所减退，用药量应酌减。

【禁忌证】对醋氨苯砜及磺胺类药过敏者、严重肝功能损害者和精神障碍者禁用。

【不良反应】(1)～(2) 见氨苯砜的不良反应。(3) 注射局部有疼痛感，时久还可发生局部硬块。

【用法与用量】肌内注射：一次0.225 g，隔60～75日注射1次，疗程长达数年。

【制剂与规格】醋氨苯砜注射液：① 1.5 ml：0.225 g；② 3 ml：0.45 g；③ 6 ml：0.9 g。

氯法齐明[保(乙)]

Clofazimine

【适应证】(1) 瘤型麻风。(2) 与利福平或乙硫异烟胺联合用于耐砜类药物菌株所致的感染。(3) 红斑结节性麻风反应和其他药物引起的急性麻风反应。(4) 与其他抗结核药合用于艾滋病患者并发非典型分枝杆菌感染。

【注意事项】(1) 有胃肠疾患史或肝功能损害及对氯法齐明不能耐受者慎用。(2) 应与食物或牛奶同时服用。(3) 为防止耐药性产生，应与一种或多种其他抗麻风药合用。(4) 治疗伴红斑结节麻风反应的多种杆菌性麻风时，如有神经损害或皮肤溃疡凶兆，可与肾上腺皮质激素合用。(5) 多种杆菌性（界线型、界线-瘤型和瘤型麻风）麻风疗程应持续2年以上，甚至终生给药。(6) 一日剂量超过100 mg时应严密观察，疗程应尽可能短。(7) 对诊断的干扰：可致红细胞沉降率加快、血糖、白蛋白、AST及ALT及胆红素升高，血钾降低。(8) 用药期间，患者出现腹部绞痛、恶心、呕吐、腹泻时应减量、延长给药间期或停药。

【禁忌证】对氯法齐明过敏者、严重肝、肾功能障碍和胃肠道疾患者以及孕妇、哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 皮肤黏膜着色为其主要不良反应。服药2周后即可出现皮肤和黏膜红染，呈粉红色、棕色、甚至黑色。着色程度与剂量、疗程成正比。停药2个月后色素逐渐减退，1～2年才能褪完。氯法齐明可使尿液、汗液、乳汁、精液和唾液呈淡红色，且可通过胎盘使胎儿着色，但未有致畸报道。应注意个别患者因皮肤着色反应而导致抑郁症，曾有报道，2例患者继皮肤色素减退后，因精神抑郁而自杀。(2) 70%～80%用氯法齐明治疗的患者皮肤有鱼鳞病样改变，尤以四肢和冬季为主。停药后2~3个月可好转。(3) 可致食欲减退、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等胃肠道反应。(4) 个别患者可产生眩晕、嗜睡、肝炎、上消化道出血、皮肤瘙痒等。(5) 个别患者可产生皮肤色素减退。(6) 个别报道发生阿-斯综合征。(7) 偶有服药期间发生脾梗死、肠梗阻或消化道出血而需进行剖腹探查者。因此应高度注意服药期间出现急腹症症状者。

【用法与用量】口服：(1) 成人：①耐氨苯砜的各型麻风：一次50～100 mg，一日1次，与其他一种或几种抗麻风药合用。②伴红斑结节麻风反应的各型麻风：有神经损害或皮肤溃疡凶兆者，一日口服100～300 mg，有助于减少和撤除泼尼松（一日40～80 mg）。待反应控制后，逐渐递减至一日100 mg。为使组织内达到足够的药物浓度，用药2个月后才逐渐减少泼尼松的用量。无神经损害或皮肤溃疡凶兆时，按耐氨苯砜的各型麻风处理。③治疗氨苯砜敏感的各型麻风：本品可与其他两种抗麻风药合用。如可能3药合用至少2年以上，直至皮肤涂片查菌转阴。此后，继续采用一种合适的药物。④成人一日最大量不超过300 mg。(2) 儿童：剂量尚未确认。

【制剂与规格】氯法齐明胶囊：50 mg。

氯法齐明胶丸：50 mg。

沙利度胺[保(乙)]

Thalidomide

【适应证】用于瘤型麻风反应症。

【禁忌证】儿童、孕妇及哺乳期妇女、对沙利度胺过敏者、驾驶员及机器操纵者。

【不良反应】口鼻黏膜干燥、头晕、倦怠、嗜睡、恶心、腹痛、便秘、面部水肿、面部红斑、过敏反应及多发性神经炎等。

【用法与用量】口服：成人一次25～50 mg，一日100～200 mg，或遵医嘱。

【制剂与规格】沙利度胺片：25 mg。

(其他见7.1.2.3)

9.6 抗病毒药

多数抗病毒药抗病毒谱较窄，临床疗效有限，往往对宿主细胞亦具有一定毒性。

按对不同病毒的作用，抗病毒药可分为两大类：抗非反转录病毒药和抗反转录病毒药。后者多用于治疗人类免疫缺陷病毒（HIV）感染的获得性免疫缺陷综合征（艾滋病，AIDS）。

目前临床常用品种主要有：抗流感病

毒药（金刚烷胺、奥司他韦等）、抗疱疹病毒药（阿昔洛韦、喷昔洛韦、更昔洛韦等）、广谱抗病毒药（利巴韦林、膦甲酸盐）、抗肝炎病毒药（拉米夫定、阿德福韦、恩替卡韦等）、抗 HIV 药等。

抗病毒药的作用机制有：①阻止病毒吸附于细胞的药物，因而阻止其侵入细胞内，如丙种球蛋白或高效价免疫球蛋白，通过与病毒结合以阻止其与宿主细胞结合；②阻止病毒进入细胞的药物，如金刚烷胺等；③抑制病毒核酸复制的药物，如利巴韦林、阿昔洛韦等；④抑制病毒蛋白合成的药物，如利福霉素类药物；⑤干扰素，能诱导宿主细胞产生一种抗病毒蛋白，抑制多种病毒繁殖。

临床治疗中常由于病毒基因组的自然突变及药物的选择性压力，而出现耐药性毒株。常见的耐药性毒株多见于免疫功能低下者合并单纯疱疹病毒、带状疱疹病毒、巨细胞病毒及人免疫缺陷病毒 -1 等病毒感染中，其耐药机制目前尚未阐明。

9.6.1 病毒性肝炎的药物治疗

甲型肝炎和戊型肝炎只引起急性肝炎，绝大多数病例为自限性，无特殊抗病毒治疗。急性乙型肝炎大多数亦无需抗病毒治疗。急性丙型肝炎早期应用干扰素 α 可能降低慢性化风险。慢性乙型肝炎和慢性丙型肝炎符合抗病毒治疗指征者，有关指南推荐以下抗病毒治疗。

治疗慢性乙型肝炎的一线药为普通干扰素 α（1b，2a 及 2b）和聚乙二醇干扰素 α（2a 和 2b），但后一类疗效更高。其优点为具有抗病毒和免疫调节双重作用，疗程固定、疗效比较持久；但有一定的不良反应，不适于失代偿期肝病以及正接受（或近期接受过）免疫抑制药治疗的患者。

在我国已批准用于治疗慢性乙型肝炎的核苷（酸）类似物包括拉米夫定、阿德福韦酯、恩替卡韦及替比夫定，它们也均为治疗慢性乙型肝炎的一线用药。其优点为服用方便、抗病毒活性强、无明显不良反应，且可用于失代偿期肝病患者；其缺点为血清转换率较低、疗程长且不固定、容易产生耐药性。

治疗慢性丙型肝炎的药物主要为干扰素类的普通干扰素 α（1b，2a 及 2b）和聚乙二醇干扰素 α（2a 和 2b）。利巴韦林可提高干扰素的抗丙型肝炎病毒效果，但单独应用无明显抗丙型肝炎病毒效果。目前有关临床指南均推荐聚乙二醇干扰素 α 联合利巴韦林作为首选治疗；亦可应用普通干扰素 α 联合应利巴韦林，但以前一种方案疗效显著。对于有利巴韦林禁忌证或不能耐受者，可单独应用聚乙二醇干扰素 α 或普通干扰素 α。在开始治疗之前应测定 HCV RNA 载量，最好也测定 HCV 基因型，因为病毒载量低、基因型为 2/3 型者疗效较好，所需疗程也较短。

9.6.1.1 病毒性肝炎的治疗方案

（1）慢性乙型肝炎（乙型肝炎病毒感染）

◆ 首选药物：阿德福韦酯，口服，一次 10 mg，一日 1 次。恩替卡韦，口服，一次 0.5 mg，一日 1 次。替比夫定，口服，一次 600 mg，一日 1 次。拉米夫定，口服，一次 100 mg，一日 1 次。常规干扰素 α，一次 500 万 U，隔日 1 次或一周 3 次，皮下或肌内注射。疗程为 HBeAg 阳性患者至少 6 个月；HBeAg 阴性患者至少 12 个月。聚乙二醇干扰素 α 2a，一次 180 μg，一周 1 次，皮下注射，疗程 48 周。聚乙二醇干扰素 α 2b，一次 1 μg/kg，一周 1 次，皮下注射，疗程 48 周。

◆ 说明：根据患者病情和意愿进行个体化治疗，治疗期间需至少每 3 个月监测肝功能、HBV DNA，每 6 个月监测乙肝病毒血清标志物，口服阿德福韦酯患者需注意监测肾功能。应用干扰素类应定期检测血常规。

（2）丙型肝炎（丙型肝炎病毒感染）

◆ 首选药物：利巴韦林，口服，一次 400 mg，一日 2 次。联合聚乙二醇干扰素 α 2a，一次 180 μg，皮下或肌内注射，一周 1 次，疗程 48 周。利巴韦林，口服，一次 400 mg，一日 2 次；联合聚乙二醇干扰素 α 2b，一次 1 μg/kg，皮下注射，一周 1 次，疗程 48 周。

◆ 次选药物：利巴韦林，口服，一次 400 mg，一周 2 次。联合常规干扰素 α，

一次 300 万 U，皮下或肌内注射，隔日 1 次，疗程 24 ~ 48 周。

◆ 说明：根据年龄和体重调整利巴韦林用量，按治疗方案监测血常规、肝功能和 HCV RNA。有利巴韦林禁忌证者可单用干扰素类治疗。

（3）丁型肝炎（丁型肝炎病毒）

◆ 首选药物：可用干扰素类药物治疗，具体剂量和疗程，参考“慢性乙型肝炎”。

◆ 说明：丁型肝炎病毒复制依赖于 HBsAg 外壳，因此仅见于 HBsAg 阳性者。

9.6.1.2 用于病毒性肝炎的抗病毒药

拉米夫定 [保（乙）]

Lamivudine

【适应证】乙型肝炎病毒复制的慢性乙型肝炎。

【注意事项】（1）治疗期间应对患者的临床情况及病毒学指标进行定期检查。（2）少数患者停止使用后，肝炎病情可能加重。因此如果停用，要对患者进行严密观察，若肝炎恶化，应考虑重新使用拉米夫定治疗。（3）肌酐清除率每分钟 < 30 ml 者，不建议使用。肝脏损害者不影响拉米夫定的药物代谢过程。（4）拉米夫定治疗期间不能防止患者感染他人，故仍应采取适当防护措施。（5）孕妇服用后仍应对新生儿进行常规的乙型肝炎免疫接种。（6）妊娠 3 个月以上的患者使用需权衡利弊。（7）哺乳期妇女服用时暂停哺乳。（8）目前尚无 16 岁以下患者的疗效和安全性资料。

【禁忌证】对拉米夫定或制剂中任何成分过敏者及妊娠 3 个月内的患者禁用。

【不良反应】常见上呼吸道感染样症状、头痛、恶心、身体不适、腹痛和腹泻，症状一般较轻并可自行缓解。

【用法与用量】口服：成人一次 0.1 g，一日 1 次。

【制剂与规格】拉米夫定片：0.1 g。

齐多夫定－拉米夫定片：齐多夫定 300mg，拉米夫定 150mg。用于治疗 HIV 感染。口服：12 岁以上患者，一次 1 片，一日 2 次。

阿德福韦酯 [保（乙）]

Adefovir Dipivoxil

【适应证】用于乙型肝炎病毒活动复制证据、并伴有 ALT 或 AST 持续升高或肝脏组织学活动性病变的肝功能代偿的成年慢性乙型肝炎患者。

【注意事项】（1）患者停止治疗会发生急性加重，停止治疗的患者应密切监测肝功能，若必要，应重新进行抗乙肝治疗。（2）在肾功能障碍或潜在肾功能障碍风险的患者，会导致肾毒性，应密切监测肾功能并适当调整给药间隔时间。（3）使用前，应进行人类免疫缺陷病毒（HIV）抗体检查。使用药物，可能出现 HIV 耐药。（4）单用核苷类似物或合用其他抗反转录病毒药物会导致乳酸性酸中毒和严重的伴有脂肪变性的肝大，包括致命事件。（5）建议用阿德福韦酯治疗的育龄妇女要采取有效的避孕措施。（6）妊娠妇女慎用。（7）哺乳期妇女使用本品应避免哺乳。（8）在 18 岁以下儿童不宜应用。在 65 岁以上老年患者中的疗效和安全性尚未明确。

【禁忌证】对阿德福韦酯过敏者禁用。

【不良反应】常见虚弱、头痛、恶心、腹痛、腹胀、腹泻和消化不良。

【用法与用量】口服：成人一次 10 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】阿德福韦酯片：10 mg。

恩夫韦肽 [保（乙）]

Enfuvirtide

【适应证】与其他抗反转录病毒药物联合，用于治疗 HIV-1 感染的患者。

【注意事项】（1）与其他抗反转录病毒药物一样，本品必须作为联合方案中的一部分使用。

（2）对非 HIV-1 感染个体（例如用于暴露后预防）使用可能会诱导产生抗恩夫韦肽抗体，可能导致抗 HIV ELISA 测试出现假阳性结果。（3）只有当潜在利益大于对胎儿的潜在风险时，孕妇才可以使用。（4）正在使用本品是不要母乳喂养，因为有潜在的 HIV 转移的风险以及可能的对婴儿产生不良反应的风险。

【禁忌证】已知对本品或所含成分过敏的患者禁用。

【不良反应】注射部位轻至中度疼痛或不适，不影响日常活动。少量引起的过敏反应，包括皮疹、发热、恶心呕吐、颤抖、僵直、低血压和血清ALT及AST升高，也可能发生原发性免疫复合物反应、呼吸窘迫和肾小球肾炎。极少数病例再次给药后出现复发。细菌性肺炎。

【用法与用量】使用前需以无菌水溶解后皮下注射给药。如果溶液溶解后不能立即使用，必须保存于2～8℃冰箱中，并在24小时内使用。冷藏的溶液注射前必须加热至室温（例如握在手中5分钟），并且注射前应检查确保溶液完全溶解，没有颗粒物。(1) 成人：推荐剂量为一次90 mg，一日2次。注射于上臂、前股部或腹部皮下。每次注射的部位应与前次不同，并且此部位当时没有局部注射反应。(2) 儿童：对6～16岁儿童患者推荐剂量为一次2 mg/kg，最大剂量为一次90 mg，一日2次，注射于上臂、前股部或腹部皮下。每次注射的部位应与前次不同，并且此部位当时没有局部反应。

【制剂与规格】注射用恩夫韦肽：每瓶内含恩夫韦肽108 mg，使用时用无菌水溶解成每1 ml含90 mg恩夫韦肽的注射液。

恩曲他滨[保(乙)]

Emtricitabine

【适应证】与其他抗病毒药物合用于成人HIV-1感染的治疗。患者为未经过反转录酶抑制药治疗和经过反转录酶抑制药治疗病毒已被抑制者。

【注意事项】(1) 肾功能不全者宜减量使用。(2) 妊娠或准备妊娠的妇女及哺乳妇女慎用。(3)儿童不推荐应用。(4)肝、肾脏、心脏功能不全者慎用，对老年人慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见有恶心、呕吐、腹泻、嗜睡、咽炎、疲乏、无力、感染、咳嗽、鼻炎等反应。

【用法与用量】口服：一次200 mg，一日1或2次，空腹或餐后服用。

【制剂与规格】恩曲他滨胶囊：200 mg。

恩替卡韦[保(乙)]

Entecavir

【适应证】用于病毒复制活跃、血清ALT持续升高或肝脏组织学显示有活动性病变的慢性成人乙型肝炎。

【注意事项】(1) 有慢性乙肝患者停止治疗后，出现重度急性肝炎发作的报道。应在医生的指导下改变治疗方法。(2) 核苷类药物在单独或与其他抗反转录病毒药物联合使用时，已经有乳酸性酸中毒和重度的脂肪性肝大，包括死亡病例的报道。(3) 使用恩替卡韦治疗并不能降低经性接触或污染血源传播HBV的危险性。因此，需要采取适当的防护措施。(4) 对妊娠妇女应用时，应当对胎儿潜在的风险利益作出充分的权衡。(5) 应采取适当的干预措施以防止新生儿感染HBV。(6) 哺乳期妇女慎用。(7) 16岁以下儿童患者使用的安全性和有效性数据尚未建立。(8) 恩替卡韦主要由肾脏排泄，在肾功能损伤的患者中，可能发生毒性反应的危险性更高。老年患者多数肾功能有所下降，因此应注意药物剂量的选择，并且监测肾功能。

【禁忌证】对恩替卡韦或制剂中任何成分过敏者。

【不良反应】(1) 常见ALT升高、疲乏、眩晕、恶心、腹痛、腹部不适、肝区不适、肌痛、失眠和皮疹。(2) 使用恩替卡韦的患者在治疗过程中发生ALT增高至10倍的正常值上限和基线值的2倍时，通常继续用药一段时间，ALT可恢复正常；在此之前或同时伴随有病毒载量2个对数值的下降。故在用药期间，需定期检测肝功能。

【用法与用量】口服：应空腹服用（餐前或餐后至少2小时）。(1) 成人一次0.5 mg，一日1次。拉米夫定治疗时病毒血症或出现拉米夫定耐药突变的患者为一日1次，一次1 mg。(2) 肾功能不全：肌酐清除率每分钟< 50 ml（包括接受血液透析或CAPD治疗的患者）应根据肌酐清除率的值调整用药剂量。①每分钟30～50 ml者：一日1次，一次0.25 mg，

拉米夫定治疗失效(1.0 mg)者,一日1次,一次0.5 mg。②每分钟10～30 ml者:一日1次,一次0.15 mg;拉米夫定治疗失效(1.0 mg)者,一日1次,一次0.3 mg。血液透析或CAPD者一日1次,一次0.15 mg;拉米夫定治疗失效(1.0 mg)者,一日1次,一次0.3 mg。血液透析后用药。

【制剂与规格】恩替卡韦片:0.5 mg。

替比夫定[保(乙)]

Telbivudine

【适应证】用于有乙型肝炎病毒活动复制证据、并伴有ATL或AST持续升高或肝脏组织学活动性病变的肝功能代偿的成年慢性乙型肝炎。

【注意事项】(1)停止治疗可能发生肝炎急性加重,停止治疗时应密切监测肝功能,若必要,应重新进行抗乙肝治疗。(2)在肾功能障碍或潜在肾功能障碍风险的患者,使用时应调整给药间隔,并密切监测肾功能。(3)与其他影响肾功能的药物合用可能会影响两者的血药浓度。(4)单用核苷类似物或合用其他抗反转录病毒药物会导致乳酸性酸中毒和严重的伴有脂肪变性的肝大,包括致命事件。(5)在治疗过程中可出现肌无力、触痛或疼痛,应及时报告医生。(6)使用替比夫定治疗并不能降低经性接触或污染血源传播HBV的危险性,需要采取适当防护措施。(7)治疗过程中患者出现头晕或疲乏时,不应驾车或使用机器。(8)对妊娠妇女只有在利益大于风险时,方可使用。哺乳期妇女使用时应避免授乳。(9)儿童和青少年不宜使用。(10)在65岁以上老年患者使用时,应监测肾功能并相应调整药物的剂量和用法。(11)服用本品期间,应当定期监测乙型肝炎生化指标、病毒学指标和血清标志物,至少每6个月1次。

【禁忌证】对替比夫定及本品的其他任何成分过敏的患者。

【不良反应】常见恶心、腹泻、腹胀、消化不良、头晕、头痛、皮疹、血淀粉酶升高、脂肪酶升高、ALT升高、CK升高等。偶见关节痛、肌痛、全身不适、AST升高等。

【用法与用量】口服:(1)成人(包括≥16岁的青少年):一日1次,一次600 mg。(2)肾功能不全:①肌酐清除率每分钟≥30～49 ml者,一次600 mg,每48小时1次;②肌酐清除率每分钟<30 ml(无须透析)者,一次600 mg,每72小时1次;③终末期肾病患者,一次600 mg,每96小时1次,应在血液透析完后服用。

【制剂与规格】替比夫定片:600 mg。

重组人干扰素α1b

Recombinant Human Interferon α1b

重组人干扰素α2a

Recombinant Human Interferon α2a

重组人干扰素α2b

Recombinant Human Interferon α2b

【适应证】(1)病毒性感染,如成人慢性乙型或丙型病毒性肝炎、带状疱疹、尖锐湿疣等。(2)肿瘤,如毛细胞性白血病、慢性髓细胞性白血病、多发性骨髓瘤、非霍奇金淋巴瘤、恶性黑色素瘤、肾细胞癌等。

【注意事项】(1)过敏体质,特别是对抗生素有过敏者,应慎用。在使用过程中如发生过敏反应应立即停药,并给予相应治疗。(2)对所有接受治疗的患者定期进行仔细的神经、精神监测。极少数接受治疗的患者可发生自杀行为,应停止治疗。如发生轻到中度肾脏,肝脏或骨髓功能低下时,需要密切监测。(3)用于治疗已有严重骨髓抑制患者时,应极为谨慎,因为本品有骨髓抑制作用,使白细胞,特别是粒细胞、血小板减少,其次是血红蛋白的降低,从而增加感染及出血的危险性。故在治疗之前及治疗中的适当时期对这些项目进行密切监测,并定期进行全血计数检查。(4)由于能增强免疫功能,所以接受移植(如肾或骨髓移植等)的患者,其免疫抑制治疗的作用可能会被变弱。(5)对儿童的安全及疗效尚未定论,故不推荐儿童使用。(6)使用干扰素的男性与女性患者必须采取有效避孕措施。(7)在孕妇,只有当其对母体的益处大于对胎儿的潜在危险时方可使用。(8)在哺乳期妇女,应

根据对母体的重要程度决定是否中止哺乳或中止用药。(9) 注射液含有赋形剂苯甲醇，对生产或剖宫产以前给予时可能对早产儿有不良反应的危险。使用时，可能会影响患者的反应速度，而使诸如驾车，操作机器等能力减退。(10) 在有心脏病或癌症晚期的老年患者，用药前及治疗期间应做心电图检查，根据需要做剂量调整或停止用药。(11) 注射用干扰素为白色疏松体冻干制剂，溶解后为无色透明液体，如遇有浑浊、沉淀等异常现象，则不得使用。(12) 注射用干扰素以注射用水溶解时应沿瓶壁注入，以免产生气泡，溶解后宜于当日用完，不得放置保存。

【禁忌证】对重组人干扰素的各种制剂及其所含的任何成分有过敏史者、患有严重心脏疾病、严重的肝肾或骨髓功能不正常、癫痫或中枢神经系统功能损伤者以及其他严重疾病不能耐受的患者。

【不良反应】(1) 常见发热、疲乏、头痛、肌痛、关节痛等，常出现在用药后第一周，不良反应多在注射 48 小时后消失。(2) 少见出现粒细胞减少、血小板减少等，停药后可恢复。(3) 偶见厌食、恶心、腹泻、呕吐、脱发、血压升高或降低、神经系统功能紊乱等。(4) 极少数患者使用后出现高血糖。有症状者应经常检查和随访血糖。(5) 极少数患者使用 α-干扰素后有严重的肝功能障碍症和肝衰竭。(6) 极少出现自身免疫现象（如脉管炎、关节炎、溶血性贫血、甲状腺功能障碍和系统性红斑狼疮）。

【用法与用量】肌内注射或皮下注射：成人。(1) 重组人干扰素 α-1b：一次 30～50 μg，一日 1 次，皮下或肌内注射。①慢性乙型肝炎，连用 4 周后改为隔日 1 次，疗程 4～6 个月，可根据病情延长疗程至 1 年。②慢性丙型肝炎，连用 4 周后改为隔日 1 次，疗程 4～6 个月，无效者停用。有效者可继续治疗至 12 个月。根据病情需要，可延长至 18 个月。疗程结束后随访 6～12 个月。③急性丙型肝炎应早期使用，可减少慢性化。④慢性粒细胞性白血病：连续用药 6 个月以上，缓解后可改为隔日 1 次。⑤毛细胞白血病一次 30～50 μg，皮下或肌内注射连续用药 6 个月以上。可根据病情适当调整，缓解后可改为隔日注射。⑥尖锐湿疣一次 10～30 mg，皮下或肌内注射或一次 10 μg，疣体下局部注射，隔日一次，连续 3 周为 1 个疗程。可根据病情延长或重复疗程。(2) 重组人干扰素 α2a：①慢性活动性乙型肝炎（适合治疗伴有 HBV-DNA，HBeAg 及 DNA 多聚酶阳性等病毒复制标志的成年患者），一次 450 万 U，一周 3 次，皮下注射，共用 6 个月。如用药 1 个月后病毒复制标志或 HbeAg 无下降，则可逐渐加大剂量并可进一步将剂量调整至患者能够耐受的水平，如治疗 3～4 个月后没有改善，则应考虑停止治疗。②慢性丙型肝炎：适合治疗 HCV 抗体阳性，ALT 增高和不伴肝脏失代偿（Child 分类的 A 级）的成年慢性丙型肝炎（非甲非乙型）患者。但没有临床和组织学方面长期好转的依据。起始剂量，一次 600 万 U，一周 3 次，皮下或肌内注射 3 个月作为诱导治疗。维持剂量，ALT 正常的患者需要再以一次 300 万 U，一周 3 次，注射 3 个月作为完全缓解的巩固治疗；ALT 不正常者必须停止治疗。③尖锐湿疣：一次 100 万～300 万 U，皮下或肌内注射，一周 3 次，疗程 1～2 个月。④毛细胞白血病：起始一日 300 万 U，皮下或肌内注射，16～24 周。耐受性差者可减量或减少周用药次数。维持：按上述剂量一周 3 次，6～20 个月。⑤多发性骨髓瘤，一次 300 万 U，皮下或肌内注射，一周 3 次，可逐周增量至最大耐受量 900 万～1 800 万 U。⑥非霍奇金淋巴瘤：一次 300 万 U，皮下注射，一周 3 次，至少 12 周。⑦慢性骨髓性白血病：18 岁以上患者，第 1～3 日，一日 300 万 U，第 4～6 日，一日 600 万 U，第 7～84 日，一日 900 万 U，可一直用药 18 个月。⑧肾细胞瘤，起始：第 1～3 日，一日 300 万 U，第 4～6 日，一日 900 万 U，第 7～9 日，一日 1 800 万 U，第 10～84 日，一日 3 600 万 U，维持：一次最大剂量 3 600 万 U，一周 3 次，8～12 周或更长。⑨黑色素瘤，起始，一次 1 800 万 U，皮下或肌内注射，一周 3 次，8～12 周。维持：一次 1 800 万 U 或最大耐受量，一周 3 次，至少 8 周，可处长至 12～24 周。

(3) 重组人干扰素 α2b：①慢性乙型肝炎和急、慢性丙型肝炎，皮下或肌内注射，一日 300万～600万U，连用4周后改为一周3次，连用16周以上。②丁型肝炎，皮下或肌内注射，一日400万～500万U，连用4周后改为一周3次，连用16周以上。③带状疱疹，肌内注射一次100万U，共6日。④尖锐湿疣，肌内注射，一日100万～300万U，共4周，也可疣体基底部注射，一次100万U。⑤毛细胞白血病，按体表面积一日200万～800万 U/m^2，肌内注射，连用至少3个月。⑥多发性骨髓瘤和非霍奇金淋巴瘤：维持治疗，300万～500万 U/m^2，肌内注射，一周3次。⑦黑色素瘤和肾细胞癌：600万U肌内注射，一周3次。

【制剂与规格】注射用重组人干扰素 α1b：① 10μg；② 20μg；③ 30μg；④ 40μg。

重组人干扰素 α1b 注射液：①1ml：10μg；② 1ml：50μg。

注射用重组人干扰素 α2a：① 100万U；② 300万U；③ 500万U；④ 600万U。

注射用重组人干扰素 α2a：① 300万U；② 450万U。

注射用重组人干扰素 α2b：① 500万U；② 600万U。

重组人干扰素 α2b 注射液：①1ml：100万U；② 1ml：300万U；③ 1ml：600万U。

聚乙二醇干扰素[保(乙)] α2a

Peginterferon Alpha 2a

【适应证】(1) 慢性乙型肝炎：适用于治疗成人慢性乙型肝炎。患者不能处于肝病失代偿期，慢性乙型肝炎必须经过血清标志物（AST、ALT、HBsAg，HBV-DNA）确诊。通常也需获取组织学证据。(2) 未接受过治疗的慢性丙型肝炎成年患者。患者必须无肝脏失代偿表现，慢性丙型肝炎须经血清标记物确证（抗HCV抗体和HCV-RNA）。通常诊断要经组织学确证。

【注意事项】(1) 有可能出现严重的精神性不良反应。不论以往是否有精神疾病，使用者都有可能出现抑郁、自杀心态和自杀企图。有抑郁症史者慎用。(2) 心血管事件，如高血压、室上性心律失常、胸痛和心肌梗死，与 α 干扰素治疗有关。心脏疾病可能被利巴韦林诱导的贫血而加重，有严重或不稳定心脏病的患者慎用。聚乙二醇干扰素 α-2a 和利巴韦林在治疗前应进行相关检查，如果出现心血管情况的恶化应暂停或终止利巴韦林的治疗。有心脏疾病的患者在开始本品治疗前进行心电图检查。(3) 在治疗中如果出现了肝功能失代偿，应考虑停止治疗并密切监测。在使用治疗过程中可能出现 ALT 升高，包括出现病毒应答的患者。如果在减低了剂量后，ALT 仍有进行性和与临床相关的升高或伴胆红素升高，则应停药。(4) 出现一过性皮疹者不需要中断治疗，严重的急性过敏反应（包括荨麻疹、血管性水肿、支气管痉挛和过敏性休克）需停药，并立即给予适当的治疗。(5) 对伴有自身免疫性疾病的患者应慎用。(6) 中性粒细胞计数 $< 1.5 \times 10^9/L$ 和血小板计数 $< 75 \times 10^9/L$ 或血红蛋白 $< 100 g/L$ 者慎用。治疗前和治疗中定期检测血液学指标。(7) 已有个别报道用药后出现眼科疾病，如视网膜出血、棉絮状渗出点、视盘水肿、视神经病变、视网膜动脉或静脉阻塞，而且可能导致视力丧失。故治疗前应进行眼部检查，如果治疗中患者出现视力下降或视野缺失则必须进行普通眼科检查。另外有糖尿病或高血压的患者在治疗中要定期进行眼部检查。出现新的眼科疾病或原有眼科疾病加重的患者应停止治疗。(8) 用药期间可能出现肺部异常，包括呼吸困难、肺浸润、肺炎、局限性肺炎。必要时，应停止使用。(9) 个别病例可出现新发银屑病或者银屑病加重。银屑病患者应慎用本品；如出现银屑病或者银屑病恶化征象，应考虑停药。(10) 治疗前，建议所有患者进行血常规检查和生化检查。下列指标是开始治疗前要达到的基础值：①血小板计数 $\geq 90 \times 10^9/L$；②中性粒细胞计数（ANC）$\geq 1.5 \times 10^9/L$；③ TSH 和 T_4 在正常范围内或甲状腺功能可以完全控制。开始治疗后，应在2周后进行血常规检查，在4周后进行生化检查。治疗期间定期

（至少每隔4周）进行上述检查。(11) 治疗中如果患者出现甲状腺功能异常的可疑症状，建议监测TSH水平。如果出现甲状腺功能异常后能通过药物方法维持TSH于正常范围，则可以继续治疗。(12) 治疗期间患者应采取有效避孕措施。男性患者服用利巴韦林期间应避免其配偶妊娠。(13) 根据药物治疗对母亲的重要性来决定停止哺乳还是停止治疗。(14) 慢性乙型肝炎患者在治疗中出现病情加重并不少见；表现为一过性和ALT大幅度升高。建议加大对此类患者肝功能的监测频率。(15) 肾功能不全患者，肌酐清除率每分钟不低于20 ml的患者不需调整剂量，但应密切监测，出现不良反应时应减量。(16) 用药的患者应避免饮酒或限制乙醇摄入量（一日最高摄入量为20 g）。(17) 患者合并感染HIV并接受高活性的抗反转录病毒治疗（HAART）时可增加乳酸酸中毒的危险性。因此在HAART同时慎与给予聚乙二醇干扰素α2a合用。(18) 合并感染并有晚期肝硬化的患者接受HAART的同时给予利巴韦林和干扰素（包括本品）联合治疗时出现肝脏失代偿的危险性增加，并可能导致死亡。(19) 慎与其他有可能引起骨髓抑制的药物合用。(20) 出现轻微头晕、意识模糊、嗜睡和疲乏者，不要驾驶和操作机器。(21) 18岁以下儿童慎用。因为本品注射液中含苯甲醇，所以不能用于新生儿和婴幼儿。(22) 要避光保存，贮存于2～8℃的冰箱内，勿冷冻或摇晃。

【禁忌证】(1) 对本品干扰素α或本制剂的任何赋型剂过敏者禁用。(2) 自身免疫性慢性肝炎患者、严重肝功能障碍或失代偿性肝硬化患者、新生儿和3岁以下儿童、有严重心脏疾病史（包括6个月内有不稳定或未控制的心脏病）患者、严重的精神疾病或病史（主要是抑郁）患者、妊娠和哺乳期禁用。

【不良反应】聚乙二醇干扰素α2a与利巴韦林联合治疗慢性丙型肝炎和本品单药治疗慢性乙型或丙型肝炎中报道的发生频率≥2%但<10%的不良反应有：①血液和淋巴系统：淋巴结肿大、贫血和血小板减少。②内分泌系统：甲状腺功能减退和甲状腺功能亢进。③精神和神经系统：记忆力障碍、味觉改变、感觉异常、感觉迟钝、震颤、情感障碍、情绪改变、神经过敏、攻击意识、性欲减退、勃起障碍。④眼部：视物模糊、眼干、眼部炎症、眼痛。⑤心脏：心悸。⑥呼吸系统：上呼吸道感染、咽痛、鼻炎、鼻咽炎、鼻窦充血、肺充血、胸部紧缩感、劳累性呼吸困难、鼻出血。⑦消化系统：胃炎、腹胀、口干、口腔溃疡、牙龈出血、牙龈炎、唇炎、便秘。⑧皮肤和皮下组织：皮肤疾病、皮疹、湿疹、银屑病、荨麻疹、光过敏反应、多汗、盗汗。⑨骨骼肌、结缔组织和骨骼：骨痛、背痛、颈部疼痛、肌肉痉挛、肌肉无力、骨骼肌疼痛。⑩全身异常和注射局部反应：流感样疾病、不适、嗜睡、寒战、潮热、虚弱、单纯疱疹、胸痛。实验室指标：包括ALT升高、电解质紊乱（低钾血症、低钙血症、低磷血症）、高血糖、低血糖和三酰甘油水平升高。本品治疗患者中观察到血液学指标下降。大多数情况下剂量调整后可获得改善，停药后4～8周内恢复到治疗前水平。轻度的中性粒细胞减少和血小板计数减少。有可能导致甲状腺功能检查指标的显著异常并需要临床干预治疗。罕见或孤立的不良事件包括下呼吸道感染、注射部位坏死、皮肤感染、外耳炎、心内膜炎、抑郁、自杀企图、药物过量、肝功能障碍、脂肪肝、胆管炎、肝癌、消化道溃疡、胃肠道出血、可逆性胰腺反应（包括淀粉酶和脂肪酶升高，伴或不伴腹痛）、心律失常、心房颤动、心包炎、眩晕、自身免疫现象（包括特发性血小板减少性紫癜、甲状腺炎、银屑病、类风湿关节炎、系统性红斑狼疮）、肌痛、骨痛、肌炎、外周神经病、结节病、致死性间质性肺炎、肺栓塞、角膜溃疡、视网膜病变、视神经病变、视力丧失、昏迷和脑出血。

【用法与用量】(1) 标准剂量：①慢性乙型肝炎：剂量为一次180 μg，一周1次，共48周，腹部或大腿皮下注射。②慢性丙型肝炎：单独用药或与利巴韦林联合应用时剂量为一次180 μg，一周1次，腹部或大腿皮下注射。联合治疗时同时口服利巴韦林。与本品联合治疗的利巴韦林的

剂量取决于病毒的基因型，基因型2或3型剂量为一日口服800 mg；基因型1型剂量为根据体重一日口服1 000 ~ 1 200 mg。利巴韦林应在进餐时服用。(2) 慢性丙型肝炎的治疗疗程：与利巴韦林联合治疗慢性丙型肝炎的疗程决定于病毒基因型。HCV基因型1型不论病毒载量如何均应治疗48周，HCV基因型2/3型不论病毒载量如何应治疗24周。HCV基因型4、5、6型感染的患者治疗可参考HCV基因型1型的治疗方案。不论病毒基因型如何，本品单药治疗的推荐疗程为48周。单药或与利巴韦林联合治疗12周内未出现病毒应答（HCV RNA未下降到50 U/ml以下，或至少未下降到基线的1%以下）的HCV基因型1型患者应考虑终止治疗。HCV基因型2/3型患者不论12周时病毒应答与否都应治疗24周。(3) 发生不良反应时的剂量调整：①当中性粒细胞计数（ANC）< 750/mm^{3}时，应考虑减量；当中性粒细胞计数（ANC）< 500/mm^{3}时，应考虑暂时停药，直到ANC恢复到> 1 000/mm^{3}时，可再恢复治疗。重新治疗开始应使用90 μg，并应监测中性粒细胞计数。②当血小板计数< 50 000/mm^{3}时，应将本品剂量减低至90 μg；当血小板计数< 25 000/mm^{3}时，应考虑停药。③在丙型肝炎患者治疗中出现治疗相关的贫血时特别推荐采取下列步骤处理：患者无明显心血管疾病，出现血红蛋白< 10 g/dl和≥ 8.5 g/dl；或当患者心血管疾病稳定，在治疗期间的任意4周内血红蛋白下降≥ 2 g/dl时利巴韦林应减量至一日600 mg（早晨200 mg，晚上400 mg）。不推荐恢复至最初的用药剂量。④出现下列情况时利巴韦林应暂停使用：患者无明显心血管疾病，血红蛋白确实下降至8.5 g/dl以下；或者患者心血管疾病稳定，在减量治疗4周后血红蛋白仍持续低于12 g/dl。当恢复正常值后可重新开始使用利巴韦林一日600 mg，经主治医师决定可以进一步增加到一日800 mg，但不推荐恢复至最初的剂量。⑤当丙型肝炎患者出现ALT持续升高时，应考虑将剂量减至135 μg。减量后，如ALT仍持续升高，或发生胆红素升高或肝功能失代偿时，应考虑停药。⑥慢性乙型肝炎患者常见到ALT一过性升高，如果剂量减小或暂时停止了治疗，当ALT水平正常后可以继续恢复常规治疗。(4) 特殊人群：①18岁以下患者，尚无安全性和有效性资料。②肾功能不全患者，对肌酐清除率每分钟大于20 ml的患者不需调整剂量。对终末期肾功能进行血液透析的患者，清除率下降25% ~ 45%，135 μg剂量下的暴露量与肾功能正常患者180 μg剂量的相似。

【制剂与规格】聚乙二醇干扰素α2a注射液（西林瓶）：①1 ml：135 μg；②1 ml：180 μg。

聚乙二醇干扰素α2a注射液：①0.5 ml：135 μg；②0.5 ml：180 μg。

聚乙二醇干扰素[保(乙)]α2b

Peginterferon Alpha 2b

【适应证】用于成人慢性丙型肝炎，并患有代偿性肝脏疾病。

【注意事项】(1) ~ (13) 见聚乙二醇干扰素α2a的注意事项 (1) ~ (13)。(14) 肾功能不全的患者应密切监测其毒性征兆和症状。(15) 尽管使用干扰素期间发热可能与常见的流感样综合征有关，但必须排除持续性发热的其他原因。(16) 某些患者在使用α干扰素时可见与脱水有关的低血压，故用药患者应保持充足的水分，必要时补液。(17) 在治疗期间，建议监测血脂水平。(18) 在治疗期间出现疲劳感、嗜睡或意识障碍的患者应告诫其避免驾驶或操作机器。

【禁忌证】(1) 对聚乙二醇干扰素α2b或任何一种干扰素或某一赋形剂过敏者。(2) 自身免疫性肝炎或有自身免疫性疾病病史者以及肝功能失代偿者或严重的肾衰竭患者（肌酐清除率每分钟< 50 ml）禁用。

【不良反应】(1) 多数不良反应为轻度或中度，治疗不受影响。(2) 十分常见注射部位疼痛／炎症、疲乏感、寒战、发热、压抑感、关节痛、恶心、脱发、骨骼肌疼痛、易激动、流感样症状、失眠、腹泻、腹痛、虚弱、咽炎、体重下降、厌食、焦虑、注意力障碍、头痛、头晕及注射部位反应等。(3) 常见瘙痒、皮肤干燥、不适感、出汗

增加、身体右上象限痛、中性粒细胞减少、白细胞减少、贫血、皮疹、呕吐、口干、情绪不稳、精神紧张、呼吸困难、病毒感染、嗜睡、甲状腺功能失调、胸痛、消化不良、面红、感觉异常、咳嗽、激动不安、鼻旁窦炎、张力过强、感觉过敏、视物模糊、意识障碍、胃肠胀气、性欲减退、皮肤红斑、眼痛、情感淡漠、感觉减退、稀粪、结膜炎、鼻充血、便秘、眩晕、月经过多、月经失调。(4）精神方面的症状并不常见。危及生命的精神症状极少发生。这些反应包括自杀、企图自杀、自杀构想和幻觉。(5）在接受0.5 μg/kg或1.0 μg/kg本品治疗的患者中，粒细胞减少（$<0.75\times10^9$/L）发生率分别为4%及7%，血小板减少（$<70\times10^9$/L）发生率分别为1%及3%。

【用法与用量】(1）对于0.5 μg/kg规格注册的国家。建议剂量为0.5 μg/kg，一周1次皮下注射，至少1年。治疗应在有丙型肝炎治疗经验的医生指导下开始。治疗期为连续1年。本品应在一周的同一日注射。一次给药时应更换注射部位。在用药6个月后HCV-RNA未消失的患者，应停止治疗。(2）对于0.5 μg/kg规格未注册的国家。建议剂量为0.5或1.0 μg/kg，一周1次皮下注射，至少6个月。剂量选择应依预期效果及安全性而定。治疗应在有丙型肝炎治疗经验的医生指导下开始。在用药6个月后HCV-RNA消失的患者，应再继续治疗6个月，即治疗1年。一次给药时应更换注射部位。对用药6个月后HCV-RNA仍未消失的患者，应停用治疗。(3）联合治疗。与利巴韦林合用时，本品剂量可达1.5 μg/kg，一周1次皮下注射。利巴韦林的剂量是根据患者的体重计算的。利巴韦林胶囊的量一日分2次口服，进餐时服用（早和晚）。疗程不少于6个月。①基因型-1：患者接受6个月治疗后，检查为丙型肝炎病毒RNA阴性，需要外加6个月疗程（即共计1年）。②基因型-非1：患者接受6个月治疗后，检查为丙型肝炎病毒RNA阴性根据其他的预后因素（如年龄＞40岁、男性、桥接纤维化）的患者来决定是否延长疗程至1年。患者接受12周治疗后，如果表现有病毒学应答，需要再继续9个月疗程（即共计1年）。剂量的调整：若治疗期间出现严重副作用和实验室指标进行性异常，建议适当调整剂量直至不良反应消失。

【制剂与规格】注射用聚乙二醇干扰素α2b：① 50 μg；② 80 μg；③ 100 μg；④ 120 μg；⑤ 150 μg。

利巴韦林[基(基)，保(甲/乙)]

Ribavirin

【适应证】用于呼吸道合胞病毒引起的病毒性肺炎与支气管炎，肝功能代偿期的慢性丙型肝炎患者。

【注意事项】(1）长期或大剂量服用对肝功能、血象有不良反应。有严重贫血、肝功能异常者慎用。(2）对诊断的干扰：口服后引起血胆红素增高者可高达25%。大剂量可引起血红蛋白含量下降。(3）哺乳期妇女在用药期间需暂停哺乳。(4）不推荐老年人应用。

【禁忌证】(1）对利巴韦林过敏者、孕妇。(2）治疗前6个月内不稳定和未控制的心脏病、血红蛋白异常、重度虚弱患者、重度肝功能异常或失代偿期肝硬化、自身免疫病（包括自身免疫性肝炎），不能控制的严重精神失常及儿童期严重精神病史者。

【不良反应】常见贫血、乏力等，停药后即消失。少见疲倦、头痛、失眠、食欲减退、恶心、呕吐、轻度腹泻、便秘等，并可致红细胞、白细胞及血红蛋白下降。

【用法与用量】口服：成人①体重＜65 kg者，一次400 mg，一日2次；②体重65～85 kg者早400 mg，晚600 mg；③体重＞85 kg者一次600 mg，一日2次。

【制剂与规格】利巴韦林片：① 20 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

利巴韦林含片：① 20 mg；② 100 mg。

利巴韦林胶囊：① 100 mg；② 150 mg。

利巴韦林口服液：5 ml：0.15 g。

利巴韦林颗粒：① 50 mg；② 100 mg；③ 150 mg。

利巴韦林滴眼液：① 0.8 ml：0.8 mg；② 8 ml：8 mg。

利巴韦林眼膏：① 2 g：0.8 mg；② 2.5 g：12.5 mg。

9.6.2 获得性免疫缺陷综合征的药物治疗

获得性免疫缺陷综合征（aquired immunodeficiency syndrome，AIDS，艾滋病）的药物治疗包括艾滋病及其常见机会性感染的治疗。

9.6.2.1 获得性免疫缺陷综合征及其药物治疗

◆ 病原体：人免疫缺陷病毒。

◆ 首选药物：齐多夫定，一次 300 mg，一日 2 次。拉米夫定一次 300 mg，一日 1 次；或一次 150 mg，一日 2 次。司坦夫定一次 30 mg，一日 2 次。依非韦仑一次 600 mg，一日 1 次空腹，睡前服用较好；奈韦拉平，一次 200 mg，一日 1 次，共 14 日，然后一次 200 mg，一日 2 次。

◆ 次选药物：去羟肌苷，体重＞60 kg 者，一次 200 mg（咀嚼片），一日 2 次；或一次 250 mg（散剂），一日 2 次；体重＜60 kg 者，一次 125 mg（咀嚼片），一日 2 次；或一次 167 mg（散剂），一日 2 次；建议餐前至少半小时或餐后 2 小时服用。阿巴卡韦，一次 300 mg，一日 2 次或一次 600 mg，一日 1 次。替诺福韦，一次 300 mg，一日 1 次；茚地那韦，一次 800 mg，一日 2 次；餐前 1 小时或餐后 2 小时服用（要多饮水，每天排尿 1.5 L 以上）。洛匹那韦／利托那韦（克力芝）一次 3 粒，一日 2 次。

◆ 说明：获得性免疫缺陷综合征的抗病毒治疗一定要 3 种药物联合使用。未接受抗病毒治疗患者的一线方案，齐多夫定或司坦夫定＋拉米夫定＋奈韦拉平；对奈韦拉平不能耐受或禁忌的患者选用，齐多夫定或司坦夫定＋拉米夫定＋依非韦仑。

9.6.2.2 获得性免疫缺陷综合征的常见机会性感染及其药物治疗

（1）病毒感染

①巨细胞病毒感染

◆ 首选药物：更昔洛韦，静脉滴注，一次 5 ~ 7.5 mg/kg，每 12 小时 1 次，14 ~ 21 日；以后改为 5 mg/kg，一日 1 次，或口服一次 1 g，一日 3 次长期预防治疗。

◆ 次选药物：膦甲酸钠，静脉滴注，一次 90 mg/kg，每 12 小时 1 次，14 ~ 21 日；以后改为 90 ~ 120 mg，一日 1 次。

◆ 说明：当给予抗人免疫缺陷病毒治疗后 $CD4^{+}T$ 细胞数大于 100/μl 且达 6 个月以上时，可以停止预防治疗。对巨细胞病毒视网膜炎患者，也可选用眼球内植入缓释更昔洛韦装置治疗。

②单纯／带状疱疹病毒感染。

◆ 首选药物：阿昔洛韦，单纯疱疹，一次 200 mg，一日 5 次，疗程 10 日；带状疱疹，一次 800 mg，一日 5 次，疗程 7 ~ 10 日。

（2）分枝杆菌感染

①结核分枝杆菌感染

◆ 首选药物：异烟肼，0.3 g（或 5 mg/kg），一日 1 次；利福平，0.45 ~ 0.6 g（或 10 mg/kg），一日 1 次；吡嗪酰胺，1.5 g（或 15 ~ 30 mg/kg），分 3 次口服；乙胺丁醇，一次 0.75 ~ 1.0 g（或 15 ~ 25 mg/kg），分 3 次口服。

◆ 次选药物：对氨基水杨酸钠，一日 2 g，一日 4 次；阿米卡星，肌内注射，一次 400 mg，一日 1 次。

◆ 说明：应避免用利福喷汀代替利福平。四联抗结核药物强化治疗 2 个月，再用利福平＋异烟肼维持治疗 4 个月。若胸部 X 线片示存在空洞或抗结核治疗 2 个月后仍有临床症状或细菌学检查。阳性者，抗结核治疗疗程可延长至 9 个月。

②鸟分枝杆菌复合体感染

◆ 首选药物：克拉霉素，一次 500 mg，一日 2 次；联用乙胺丁醇，一次 15 mg/kg，一日 1 次。

◆ 次选药物：克拉霉素替代用药：阿奇霉素，一次 500 ~ 600 mg，一日 1 次。第 3/ 第 4 选用药：环丙沙星，一次 500 ~ 600 mg，一日 2 次；或左氧氟沙星，一次 500 mg，一日 1 次；或莫西沙星，一次 400 mg，一日 1 次；或阿米卡星，静脉滴注，一次 10 ~ 15 mg/kg，一日 1 次。

（3）真菌感染

①肺孢子菌肺炎

◆ 首选药物：急性期：复方磺胺甲噁唑片（含磺胺甲噁唑 400 mg 和甲氧苄啶

80 mg)，一次 4 片，每 8 小时 1 次，口服 21 日。维持期：一次 2 片，一日 1 次。

◆ 次选药物：氨苯砜，一次 100 mg，一日 1 次，联用甲氧苄啶，一次 5 mg/kg，一日 3 次。或伯氨喹，一次 15 ~ 30 mg，一日 1 次，联用克拉霉素，一次 300 ~ 450 mg，每 8 小时 1 次。

◆ 说明：若 $PaO_2 < 70$ mmHg 或 P (A-a) $O_2 > 35$ mmHg，则加用泼尼松，第 1 ~ 5 日一次 40 mg，一日 2 次；第 6 ~ 10 日一次 40 mg；第 11 ~ 21 日一次 20 mg。$CD4^+$T 细胞 <200/μl，需预防性治疗：复方磺胺甲噁唑片，一次 1 ~ 2 片，一日 1 次。

②念珠菌感染

——口腔炎

◆ 首选药物：开始治疗的 7 ~ 14 日用氟康唑，口服一次 100 mg，一日 1 次；或伊曲康唑口服液，一次 200 mg，一日 1 次；或口服克霉唑，一次 10 mg，一日 5 次；或口服制霉菌素混悬液，一次 4 ~ 6 ml，每 6 小时 1 次。

◆ 次选药物：对氟康唑耐药者，口服伊曲康唑，一次 200 mg，一日 1 次；或静脉滴注两性霉素 B，一次 0.3 mg/kg，一日 1 次；或静脉滴注卡泊芬净，首剂 70 mg，后改为一次 50 mg，一日 1 次。

◆ 说明：复发性感染或引起功能障碍时，长期服用吡咯类抗真菌药。

——食管炎

◆ 首选药物：开始治疗的 14 ~ 21 日，氟康唑，口服或静脉滴注，一次 100 mg（可增至 400 mg），一日 1 次；或口服伊曲康唑，一次 200 mg，一日 1 次；或口服伏立康唑，一次 200 mg，每 12 小时 1 次；或静脉滴注卡泊芬净，一次 50 mg，一日 1 次；或静脉滴注米卡芬净，一次 150 mg，一日 1 次；或一次 300 mg，隔日 1 次。

◆ 次选药物：对氟康唑耐药的食管炎，静脉滴注卡泊芬净 50 mg 一日 1 次或伏立康唑，口服一次 200 mg，每 12 小时 1 次；或静脉滴注两性霉素 B，一次 0.3 ~ 0.7 mg/kg，一日 1 次；或静脉滴注脂质体两性霉素 B，一次 3 ~ 5 mg/kg，一日 1 次；或静脉滴注两性霉素 B 脂质体复合物，一日 5 mg/kg。

◆ 说明：静脉滴注米卡芬净一日 100 mg 或 150 mg 与氟康唑一日 200 mg 疗效相等。复发率亦相似。

——外阴阴道炎

◆ 首选药物：局部用制霉菌素（阴道片）一日 10 万 U，连续 14 日。氟康唑，口服，一次 150 mg。伊曲康唑，口服，一次 200 mg，一日 2 次；或一日 200 mg，连续 3 日。

◆ 说明：口服和阴道内给药同样有效，避免穿紧身衣裤，口服药物可减少复发。

③新型隐球菌感染：隐球菌脑膜炎

◆ 首选药物：两性霉素 B，静脉滴注，一次 0.7 mg/kg，一日 1 次；或脂质体两性霉素 B，一次 4 mg/kg，一日 1 次，合并应用氟胞嘧啶口服，一次 25 mg/kg，每 6 小时 1 次；持续 2 周。

◆ 次选药物：氟康唑，口服或静脉滴注，一次 400 ~ 800 mg；一日 1 次；或氟康唑，口服或静脉滴注，一次 400 ~ 800 mg，一日 1 次；合并应用氟胞嘧啶口服，一次 25 mg/kg，每 6 小时 1 次，持续 4 ~ 6 周。

◆ 说明：两性霉素 B + 氟胞嘧啶比两性霉素 B + 氟康唑或三药联合使用效果好。如果患者精神状态正常，脑脊液中细胞数 $>0.02 \times 10^9$/L 和脑脊液隐球菌抗原滴度 < 1 : 1 024，可单用氟康唑。

④组织胞浆菌感染

——肺组织胞浆菌病

◆ 首选药物：初始预防：CD4 < 150/mm^3 患者来自流行地区者，伊曲康唑 200 mg 口服，一日 1 次。严重播散：急性期，两性霉素 B，静脉滴注，0.7 mg/kg，一日 1 次；或脂质体两性霉素 B，静脉滴注，4 mg/kg，一日 1 次（用 3 ~ 10 日或直至临床好转）。持续期：伊曲康唑，口服，一次 200 mg，每 12 小时 1 次（12 周）。次严重播散：伊曲康唑，口服一次 200 mg，每 8 小时 1 次，3 日；然后一次 200 mg，每 12 小时 1 次，12 周。

◆ 次选药物：严重播散：急性期，伊曲康唑，静脉滴注，一次 400 mg，一日 1 次。持续期，伊曲康唑，口服，一次 200 mg，每 12 小时 1 次；或氟康唑，口服，一次

800 mg，一日 1 次。轻播散，氟康唑，口服一次 800 mg，一日 1 次。

◆ 说明：急性肺组织胞浆菌病在 HIV-1 感染患者 CD4 > 500/mm³ 可不用治疗。伊曲康唑 200 mg，一日 1 次，是维持治疗最佳药物。氟康唑比伊曲康唑作用差，且容易诱导耐药。

——脑膜炎

◆ 首选药物：两性霉素 B 或脂质体两性霉素 B，12 ~ 16 周。维持治疗：用 HAART 后 CD4 上升，伊曲康唑，口服一次 200 mg，一日 1 次，不定期。

◆ 次选药物：两性霉素 B，静脉滴注，一次 1 mg/kg，一周或隔周一次，不定期。

（4）原虫感染：弓形虫感染

◆ 首选药物：急性期：乙胺嘧啶，首剂 200 mg，以后一次 50 mg（< 60 kg）或 75 mg（> 60 kg），一日 1 次。联用磺胺嘧啶 1.0 g（< 60 kg），亚叶酸 10 ~ 20 mg，一日 1 次，至少 6 周。维持期：乙胺嘧啶，一次 50 mg，一日 1 次；磺胺嘧啶 1.0 g，每 12 小时 1 次；亚叶酸 15 mg，一日 1 次。

◆ 次选药物：乙胺嘧啶和亚叶酸，剂量同前，合用克拉霉素，一次 600 mg，每 6 小时 1 次；或阿奇霉素，一次 900 ~ 1 200 mg，一日 1 次；或复方磺胺甲噁唑片，一次 5 mg/kg，一日 2 次。

◆ 说明：$CD4^+$T 细胞 < 200/μl 且弓形虫抗体 IgG 阳性时，需预防性治疗：复方磺胺甲噁唑片：一次 2 片，一日 1 次。

9.6.3 其他病毒感染的治疗药

奥司他韦[保(乙)]

Oseltamivir

【适应证】(1) 成人以及 1 岁和 1 岁以上儿童的甲型和乙型流感治疗。(2) 成人以及 13 岁和 13 岁以上青少年的甲型和乙型流感的预防。

【注意事项】(1) 尚无证据显示对甲型流感和乙型流感以外的其他疾病有效。(2) 对 1 岁以下儿童治疗流感、对 13 岁以下儿童预防流感、在健康状况差或不稳定必须入院的患者、在免疫抑制的患者以及并有慢性心脏和（或）呼吸道疾病的患者治疗流感的安全性和有效性尚不确定。(3) 奥司他韦不能取代流感疫苗；其使用不应影响每年接种流感疫苗；只有在可靠的流行病学资料显示社区出现了流感病毒感染后才考虑用于治疗和预防。(4) 对肌酐清除率每分钟 10 ~ 30 ml 的患者，用于治疗和预防的推荐剂量应做调整。不推荐用于肌酐清除率每分钟小于 10 ml 的患者和严重肾衰竭需定期进行血液透析和持续腹膜透析的患者。(5) 妊娠和哺乳期妇女只有在对哺乳母亲的预期利益大于对婴儿的潜在危险时才可服用。(6) 应对患者自我伤害和谵妄事件进行密切监测。

【禁忌证】对奥司他韦及制剂中任何成分过敏者。

【不良反应】极少见皮肤发红、皮疹、皮炎和大疱疹、肝炎和 AST 及 ALT 升高、胰腺炎、血管性水肿、喉部水肿、支气管痉挛、面部水肿、嗜酸性粒细胞升高、白细胞下降和血尿。

【用法与用量】(1) 口服：在流感症状开始的第 1 日或第 2 日开始治疗。①成人和青少年（13 岁以上）：一次 75 mg，一日 2 次，共 5 日。②儿童（1 岁以上）：体重 ≤ 15 kg，一次 30 mg，一日 2 次，共 5 日；体重 15 ~ 23 kg，一次 45 mg，一日 2 次，共 5 日；体重 23 ~ 40 kg，一次 60 mg，一日 2 次，共 5 日；体重 > 40 kg，一次 75 mg，一日 2 次，共 5 日。(2) 预防：在密切接触后 2 日内开始用药；或流感季节时预防流感；一次 75 mg，一日 1 次，至少 7 日。有数据表明连用药物 6 周安全有效。服药期间一直具有预防作用。(3) 肾功能不全患者剂量的调整：①治疗：对肌酐清除率为每分钟 10 ~ 30 ml，一次 75 mg，一日 1 次，共 5 日。用于肌酐清除率每分钟小于 10 ml 者和严重肾衰竭、需定期进行血液透析或持续腹膜透析的患者。无肾衰竭儿童的用药剂量资料。②预防：对肌酐清除率为每分钟 10 ~ 30 ml 者，一次 75 mg。隔日 1 次；或一日 30 mg。不推荐用于终末期肾衰竭的患者，包括慢性定期血液透析、持续腹膜透析或肌酐清除率每分钟小于 10 ml 的患者。

【制剂与规格】磷酸奥司他韦胶囊（以

奥司他韦计)：75 mg。

金刚烷胺[基(基). 保(甲)]

Amantadine

【适应证】(1) 帕金森病、帕金森综合征、药物诱发的锥体外系疾病，一氧化碳中毒后帕金森综合征及老年人合并有脑动脉硬化的帕金森综合征。(2) 防治A型流感病毒所引起的呼吸道感染。

【注意事项】(1) 下列情况下应在严密监护下使用：有癫痫史、精神错乱、幻觉、充血性心力衰竭、肾功能不全、外周血管性水肿或直立性低血压的患者。(2) 治疗帕金森病时不应突然停药。(3) 用药期间不宜驾驶车辆，操纵机械和高空作业。(4) 每日最后一次服药时间应在下午4时前，以避免失眠。(5) 孕妇和老年患者应慎用。

【禁忌证】对金刚烷胺过敏者、新生儿和1岁以下婴儿、哺乳期妇女。

【不良反应】常见眩晕、失眠和神经质，恶心、呕吐、厌食、口干、便秘。少见白细胞减少、中性粒细胞减少。偶见抑郁、焦虑、幻觉、精神错乱、共济失调、头痛。罕见惊厥。

【用法与用量】口服：①成人：帕金森病、帕金森综合征，一次100 mg，一日1～2次，一日最大剂量为400 mg；抗病毒，一次200 mg，一日1次；或一次100 mg，每12小时1次；②儿童：抗病毒，1～9岁，按体重一次1.5～3 mg/kg，8小时1次，或一次2.2～4.4 mg/kg，12小时1次。9～12岁，每12小时口服100 mg。12岁及12岁以上，用量同成人。

【制剂与规格】盐酸金刚烷胺片：0.1 g。

盐酸金刚烷胺胶囊：0.1 g。

金刚乙胺[保(乙)]

Rimantadine

【适应证】用于预防A型流感病毒株引起的感染；可补充接种的预防作用；可用于儿童以及成人。

【注意事项】(1) 慎用于癫痫或肾衰竭患者以及老年人。(2) 动物实验研究虽无致畸性，但妊娠妇女使用应斟酌利弊。(3) 本品可随乳汁排出，哺乳期妇女慎用。(4) 1岁以下婴儿使用本品尚无经验，故不推荐使用。(5) 金刚烷类药物可改变患者的注意力和反应性。

【禁忌证】对金刚烷类药物过敏者及严重肝功能不全者禁用。

【不良反应】(1) 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹痛、食欲缺乏、腹泻。(2) 神系统障碍：神经过敏、失眠、集中力差、头晕、头痛、老年人步态失调。(3) 其他：无力、口干。以上不良反应在继续用药后均可消失。

【用法与用量】口服：成人及10岁以上儿童为一日0.2 g，可1次或分2次给药。预防性治疗的开始及持续时间依接触类型而定。与病毒性流感患者密切接触如为同一家庭的成员时应在24～48小时内开始给药，并持续8～10日。无密切接触而进行季节性预防：应在病原体鉴定为A型流感病毒后即开始给药，预防性治疗应持续4～6周。老人因肾清除率降低，剂量应减至一日0.1 g，1次或分2次给药；1～10岁儿童，一日按体重5 mg/kg (不超过150 mg)，1次或分2次服。

【制剂与规格】盐酸金刚乙胺片：0.1g。

盐酸金刚乙胺颗粒：2 g：50 mg (以盐酸金刚乙胺计)。

沙奎那韦[保(乙)]

Saquinavir

【适应证】与其他药物合用治疗严重的HIV感染。

【注意事项】肝功能不全者慎用。

【不良反应】腹泻、恶心和腹部不适。

【用法与用量】口服：一日3次，一次600 mg，饭后服用。合用药物剂量：齐多夫定，一次200 mg，一日3次；扎西胞苷一次0.75 mg，一日3次。

【制剂与规格】甲磺酸沙奎那韦片：600 mg。

阿昔洛韦[基(基). 保(甲/乙)]

Aciclovir

【适应证】(1) 单纯疱疹病毒感染：免疫缺陷者初发和复发性黏膜皮肤感染的

治疗以及反复发作病例的预防；单纯疱疹性脑炎治疗。(2) 带状疱疹：治疗免疫缺陷者严重带状疱疹或免疫功能正常者弥散型带状疱疹。(3) 免疫缺陷者水痘。(4) 急性视网膜坏死。

【注意事项】(1) 对更昔洛韦过敏者也可能对阿昔洛韦过敏。(2) 宜缓慢静脉滴注，以避免本品可在肾小管内沉积，导致肾功能损害（据报告发生率可达 10%）。并应防止药液漏至血管外，以免引起疼痛及静脉炎。(3) 以下情况需考虑用药利弊：脱水患者，剂量应减少。严重肝功能不全者、对阿昔洛韦不能耐受者、精神异常或以往对细胞毒性药物出现精神反应者，应用时易产生精神症状，需慎用。(4) 严重免疫功能缺陷者长期或多次应用治疗后可能引起单纯疱疹病毒和带状疱疹病毒对阿昔洛韦耐药。如单纯疱疹患者应用后皮损不见改善者应测试对阿昔洛韦的敏感性。(5) 随访检查：由于生殖器疱疹患者大多易患子宫颈癌，因此患者至少应 1 年检查 1 次，以早期发现。静脉用药可能引起肾毒性，用药前或用药期间应检查肾功能。(6) 静脉滴注后 2 小时，尿药浓度最高，此时应给患者充足的水，防止药物沉积于肾小管内。(7) 一次血液透析可使血药浓度降低 60%，故一次血液透析 6 小时应重复初给一次剂量。(8) 肥胖患者的剂量应按标准体重计算。(9) 阿昔洛韦对单纯疱疹病毒的潜伏感染和复发无明显效果，不能根除病毒。(10) 本品呈碱性，与其他药物混合容易引起 pH 改变，应尽量避免配伍使用。(11) 孕妇用药仍需权衡利弊。哺乳期妇女和儿童应慎用。(12) 新生儿不宜以含苯甲醇的稀释液配制滴注液，否则易引起致命性的综合征，包括酸中毒、中枢抑制、呼吸困难、肾衰竭、低血压、癫痫和颅内出血等。(13) 急性或慢性肾功能不全者不宜用本品静脉滴注，滴速过快时可引起肾衰竭，监测尿糖和肾功能，避免滴速过快。

【禁忌证】对阿昔洛韦过敏者。

【不良反应】(1) 常见注射部位的炎症或静脉炎、皮肤瘙痒或荨麻疹、皮疹、发热、轻度头痛、恶心、呕吐、腹泻、蛋白尿、血液尿素氮和血清肌酐值升高、肝功能异常如 AST、ALT、碱性磷酸酶、乳酸脱氢酶、总胆红素轻度升高等。(2) 少见急性肾功能不全、白细胞和红细胞计数下降、血红蛋白减少、胆固醇、三酰甘油升高、血尿、低血压、多汗、心悸、呼吸困难、胸闷等。(3) 罕见昏迷、意识模糊、幻觉、癫痫、下肢抽搐、舌及手足麻木感、震颤、全身倦怠感等中枢神经系统症状。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：一次滴注时间在 1 小时以上。①成人。一日最高剂量按体重 30 mg/kg，或按体表面积 1.5 g/m²。重症生殖器疱疹初治，按体重一次 5 mg/kg，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 5 日。免疫缺陷者皮肤黏膜单纯疱疹或严重带状疱疹，按体重一次 5 ~ 10 mg/kg，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 7 ~ 10 日。单纯疱疹性脑炎，按体重一次 10 mg/kg，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 10 日。急性视网膜坏死，一次 5 ~ 10 mg/kg，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 7 ~ 10 日。以后一次口服 0.8 g，一日 5 次，连续 6 ~ 14 周。②小儿。小儿最高剂量每 8 小时按体表面积 500 mg/m²。重症生殖器疱疹初治，婴儿与 12 岁以下小儿，按体表面积一次 250 mg/m²，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 5 日。免疫缺陷者皮肤黏膜单纯疱疹，婴儿与 12 岁以下小儿，按体表面积一次 250 mg/m²，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 7 日，12 岁以上按成人量。单纯疱疹性脑炎，按体重一次 10 mg/kg，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 10 日。免疫缺陷者合并水痘，按体重一次 10 mg/kg，或按体表面积一次 500 mg/m²，一日 3 次，每 8 小时 1 次，共 10 日。(2) 药液的配制：取本品 0.5 g 加入 10 ml 注射用水中（浓度成为 50 g/L），充分摇匀成溶液后，再用 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液稀释至至少 100 ml，使最后药物浓度不超过 7 g/L，否则易引起静脉炎。(3) 口服：①成人。生殖器疱疹初治和免疫缺陷者皮肤黏膜单纯疱疹，一次 200 mg，一日 5 次，10 日为 1 个疗程；或一次 400 mg，一日 3 次，5 日为 1 个疗程，复发性感染，一次 200 mg，一日 5 次，5 日为 1 个疗程。复发性感染的慢性抑制

疗法，一次 200 mg，一日 3 次，6 个月为 1 个疗程；必要时剂量可加至一日 5 次，6 ~ 12 个月为 1 个疗程。带状疱疹，一次 800 mg，一日 5 次，7 ~ 10 日为 1 个疗程。水痘，40 kg 以上儿童和成人常用量为一次 800 mg，一日 4 次，5 日为 1 个疗程。肾功能不全的成人患者，按表 9-12 调整剂量。②儿童：水痘，一次 20 mg/kg，一日 4 次，5 日为 1 个疗程。2 岁以下小儿剂量尚未确立。

【制剂与规格】阿昔洛韦片：① 0.1 g；② 0.2 g；③ 0.4 g。

阿昔洛韦咀嚼片：① 0.4 g；② 0.8 g。

阿昔洛韦胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g。

注射用阿昔洛韦：① 0.25 g；② 0.5 g。

阿昔洛韦 0.9% 氯化钠注射液：① 100 ml，内含阿昔洛韦 0.1 g、氯化钠 0.9 g；② 250 ml，内含阿昔洛韦 0.25 g、氯化钠 2.25 g。

阿昔洛韦滴眼液：8 ml：8 mg。

阿昔洛韦眼膏：2 g：60 mg。

伐昔洛韦[保(乙)]

Valaciclovir

【适应证】水痘带状疱疹及Ⅰ型、Ⅱ型单纯疱疹病毒感染，包括初发和复发的生殖器疱疹病毒感染。

【注意事项】(1) 对更昔洛韦过敏者也可能对本品过敏。(2) 脱水或已有肝、肾功能不全者慎用。(3) 严重免疫功能缺陷者长期或多次应用本品治疗后可能引起单纯疱疹病毒和带状疱疹病毒对本品耐药。如单纯疱疹患者应用本品后皮损不见改善者应测试单纯疱疹病毒对本品的敏感性。(4) 随访检查：由于生殖器疱疹患者大多易患子宫颈癌，因此患者至少应 1 年检查一次，以早期发现。(5) 服药期间应给予患者充分的水，防止阿昔洛韦在肾小管内沉淀。(6) 一次血液透析可使阿昔洛韦的血药浓度减低 60%，因此血液透析后应补给一次剂量。(7) 生殖器复发性疱疹感染以间歇短程疗法给药有效。生殖器复发性疱疹的长程疗法也不应超过 6 个月。(8) 孕妇用药需权衡利弊，哺乳期妇女应慎用。(9) 老年患者由于生理性肾功能的衰退，剂量与用药间期需调整。

【禁忌证】对本品及阿昔洛韦过敏者禁用。

【不良反应】偶有头晕、头痛、关节痛、恶心、呕吐、腹泻、胃部不适、食欲减退、口渴、白细胞下降、蛋白尿及尿素氮轻度升高、皮肤瘙痒等，长程给药偶见痤疮、失眠、月经紊乱。

【用法与用量】口服：一次 0.3 g，一日 2 次，饭前空腹服用。带状疱疹连续服药 10 日。单纯性疱疹连续服药 7 日。

【制剂与规格】盐酸伐昔洛韦片：① 0.15 g；② 0.3 g。

泛昔洛韦[保(乙)]

Famciclovir

【适应证】用于带状疱疹和原发性生殖器疱疹。

【注意事项】(1) 病毒胸腺嘧啶脱氧核苷激酶或 DNA 多聚酶的质变可导致对泛昔洛韦耐药突变株的产生；对阿昔洛韦耐药的突变株对泛昔洛韦也耐药。(2) 泛昔洛韦不能治愈生殖器疱疹，是否能够防

表 9-12 肾功能不全时阿昔洛韦的用量

疾病	疗法	肌酐清除率(每分钟毫升数)	剂量(mg)	给药间隔(小时)
生殖器疱疹	起始或间歇疗法	>10	200	4（一日 5 次）
		0 ~ 10	200	12
	慢性抑制疗法	>10	400	12
		0 ~ 10	200	12
带状疱疹		>25	800	4（一日 5 次）
		10 ~ 25	800	8
		0 ~ 10	800	12

止疾病传播尚不清楚。(3) 孕妇使用需充分权衡利弊。哺乳期妇女使用本品应停止哺乳。(4) 18 岁以下患者使用本品的安全性和有效性尚未确定。(5) 65 岁以上老人服用后的不良反应的类型和发生率与年轻人相似，但服药前要监测肾功能以及及时调整剂量。

【禁忌证】对泛昔洛韦及喷昔洛韦过敏者。

【不良反应】常见头痛、恶心；此外尚可见：①神经系统：头晕、失眠、嗜睡、感觉异常等。②消化系统：腹泻、腹痛、消化不良、厌食、呕吐、便秘、胀气等。③全身反应：疲劳、疼痛、发热、寒战等。④其他反应：皮疹、皮肤瘙痒、鼻窦炎、咽炎等。

【用法与用量】口服：成人一次 0.25 g，每 8 小时 1 次。带状疱疹疗程 7 日；原发性生殖器疱疹疗程为 5 日。肾功能不全者按肌酐清除率调整剂量：成人，①每分钟 ≥ 60 ml 者，一次 0.25 g，每 8 小时 1 次。②每分钟 40 ~ 59 ml 者，一次 0.25 g，每 12 小时 1 次。③每分钟 20 ~ 39 ml 者，一次 0.25 g，每 24 小时 1 次。④每分钟 < 20 ml 者，一次 0.125 g，每 48 小时 1 次。

【制剂与规格】泛昔洛韦片：① 0.125 g；② 0.25 g。

泛昔洛韦胶囊：0.125 g。

喷昔洛韦 [保(乙)]

Penciclovir

【适应证】(1) 严重带状疱疹患者，如出血性带状疱疹，坏疽性带状疱疹，播散性带状疱，三叉神经支带状疱疹，带状疱疹脑膜炎，严重疼痛的早期带状疱疹等和免疫功能障碍并发的带状疱疹。(2) 外用治疗口唇、面部单纯疱疹及生殖器疱疹。

【注意事项】(1) 对更昔洛韦过敏者也可能对本品过敏。(2) 仅用静脉滴注给药，且应缓慢（1 小时以上），防止局部浓度过高，引起疼痛及炎症。(3) 溶液配制后应立即使用，不能冷藏，因冷藏时会析出结晶，用剩溶液应废弃，稀释药液时出现白色浑浊或结晶则不能使用。(4) 本品呈碱性，与其他药物混合时易引起溶液 pH 改变，应尽量避免配伍使用。(5) 有肾脏疾病、脱水或同时使用其他对肾脏有毒性药物的患者，应调整剂量。(6) 软膏不用于黏膜，因刺激作用，勿用于眼内及眼周。

【禁忌证】对喷昔洛韦及泛昔洛韦过敏者。

【不良反应】(1) 注射后可见头痛、头晕、肌酐清除率少量增加、血压轻度下降等。(2) 外用时偶见头痛、用药局部灼热感、疼痛、瘙痒等。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：一次 5 mg/kg，每 12 小时 1 次。(2) 外用：涂于患处，一日 4 ~ 5 次，应尽早开始治疗（如有先兆或损害出现时）。

【制剂与规格】注射用喷昔洛韦：0.25 g。

喷昔洛韦乳膏：① 2 g : 20 mg；② 5 g : 50 mg；③ 10 g : 0.1 g。

更昔洛韦 [保(乙)]

Ganciclovir

【适应证】(1) 免疫缺陷患者（包括艾滋病患者）并发巨细胞病毒视网膜炎的诱导期和维持期治疗。(2) 接受器官移植的患者预防巨细胞病毒感染及用于巨细胞病毒血清试验阳性的艾滋病患者预防发生巨细胞病毒疾病。

【注意事项】(1) 对阿昔洛韦过敏者也可能对本品过敏。(2) 并不能治愈巨细胞病毒感染，用于艾滋病患者合并感染时往往需长期维持用药，防止复发。(3) 用静脉滴注给药，一次至少滴注 1 小时以上，患者需给予充足水分，以免增加毒性。(4) 本品配制需充分溶解，浓度不能超过 10 mg/ml。本品溶液呈强碱性 (pH=11)。避免药液与皮肤或黏膜接触或吸入，如不慎溅及，应立即用肥皂和清水冲洗，眼睛应用清水冲洗，避免药液渗漏到血管外组织。(5) 本品可引起中性粒细胞减少、血小板减少，并易引起出血和感染，用药期间应注意口腔卫生。用药期间应经常检查血细胞数，初始治疗期间应每 2 日测定血细胞计数，以后为一周测定 1 次。对有血细胞减少病史的患者（包括因药物、化学品或射线所致者）或粒细胞计数低于 1.0×10^9/L 患者，应每天进行血细胞计

数。如中性粒细胞计数在 0.5×10^9/L 以下、或血小板计数低于 25×10^9/L 时应暂时停药，直至中性粒细胞数增加至 0.75×10^9/L 以上方可重新给药。少数患者同时采用粒细胞－巨噬细胞集落刺激因子（GM-CSF）治疗粒细胞减低有效。(6) 用药期间应每 2 周进行血清肌酐或肌酐清除率的测定。肾功能减退者剂量应酌减，血液透析患者用量每 24 小时不超过 1.25 mg/kg，一次透析后血药浓度约可减低 50%，故宜在透析后给药。(7) 艾滋病合并巨细胞病毒视网膜炎患者，在治疗期间应每 6 周进行一次眼科检查。对正在接受齐多夫定治疗的上述患者，常不能耐受联合使用本品，合用时甚至可出现严重白细胞减少。(8) 器官移植患者用药期间可能出现肾功能损害，尤其是与环孢素或两性霉素 B 联合用药的患者。(9) 孕妇患者及 12 岁以下小儿患者用药应充分权衡利弊哺乳期妇女用药期间应暂停哺乳。(10) 育龄妇女应用时应注意采取有效避孕措施，育龄男性应采用避孕工具至停药后至少 3 个月。

【禁忌证】对本品或阿昔洛韦过敏者禁用。

【不良反应】(1) 常见的为骨髓抑制，用药后约 40% 的患者中性粒细胞数减低至 1.0×10^9/L 以下，约 20% 的患者血小板计数减低至 50×10^9/L 下，此外可有贫血。(2) 可出现中枢神经系统症状，如精神异常、紧张、震颤等。偶有昏迷、抽搐等。(3) 可出现皮疹、瘙痒、药物热、头痛、头晕、呼吸困难、恶心、呕吐、腹痛、食欲减退、肝功能异常、消化道出血、心律失常、血压升高或降低、血尿、血尿素氮增加、脱发、血糖降低、水肿、周身不适、血肌酐增加、嗜酸性细胞增多症、注射局部疼痛、静脉炎等；有巨细胞病毒感染性视网膜炎的艾滋病患者可出现视网膜剥离。

【用法与用量】(1) 口服：用于巨细胞病毒（CMV）视网膜炎的维持治疗，在诱导治疗后，维持量为一次 1 g，一日 3 次，与食物同服。也可在非睡眠时一次服 0.5 g，每 3 小时 1 次，一日 6 次，与食物同服。若 CMV 视网膜炎有发展，则应重新进行诱导治疗。晚期 HIV 感染患者 CMV 病的预防：一次 1 g，一日 3 次，与食物同服。器官移植受者 CMV 病的预防：预防剂量为一次 1 g，一日 3 次，与食物同服。用药疗程根据免疫抑制时间和程度确定。老年患者及肾功能减退者，则应根据肌酐清除率酌情调整用量。(2) 静脉滴注，一次 1 小时以上。诱导期：按体重一次 5 mg/kg，每 12 小时 1 次，疗程 14 ～ 21 日。一次最大剂量 6 mg/kg。肾功能减退者，按肌酐清除率调整剂量：①每分钟 50 ～ 69 ml 者，每 12 小时静脉滴注 2.5 mg/kg。②每分钟 25 ～ 49 ml 者，每 24 小时静脉滴注 2.5 mg/kg。③每分钟 10 ～ 24 ml 者，每 24 小时静脉滴注 1.25 mg/kg。④每分钟 < 10 ml 者，一周给药 3 次，一次 1.25 mg/kg，于血液透析后给予。维持期：按体重一次 5 mg/kg，一日 1 次。肾功能减退者，按肌酐清除率调整剂量：①每分钟 50 ～ 69 ml 者，每 24 小时静脉滴注 2.5 mg/kg。②每分钟 25 ～ 49 ml 者，每 24 小时静脉滴注 1.25 mg/kg。③每分钟 10 ～ 24 ml 者，每 24 小时静脉滴注 0.625 mg/kg。④每分钟 < 10 ml 者，一周给药 3 次，一次 0.625 mg/kg，于血液透析后给予。(3) 预防用药，一次 5 mg/kg，每 12 小时 1 次，连续 7 ～ 14 日；继以 5 mg/kg，一日 1 次，共 7 日。(4) 静脉滴注液配制方法为将使用剂量，用适量注射用水或 0.9% 氯化钠注射液使之溶解，使浓度达 50 mg/ml，再注入 0.9% 氯化钠注射液、5% 葡萄糖注射液、复方 0.9% 氯化钠注射液或复方乳酸钠注射液 100 ml 中，滴注液浓度不得大于 10 mg/ml。

【制剂与规格】更昔洛韦胶囊：0.25 g。

注射用更昔洛韦：①50 mg；②0.15 g；③0.25 g；④0.5 g。

更昔洛韦注射液：①10 ml : 0.5 g；②5 ml : 0.25 g。

更昔洛韦滴眼液：8 ml : 8 mg。

更昔洛韦眼膏：2 g : 20 mg。

更昔洛韦眼用凝胶：5 g : 7.5 mg。

碘苷

Idoxuridine

【适应证】用于单纯疱疹性角膜炎、

牛痘病毒性角膜炎和带状疱疹病毒感染。

【注意事项】(1) 碘苷对单纯疱疹病毒Ⅱ型感染无效。(2) 可与睫状肌麻痹药、抗生素及肾上腺皮质激素合用。激素能促使病毒感染扩散，故禁用于浅层角膜炎，但可用于基质性角膜炎、角膜水肿或虹膜炎。(3) 碘苷可以阻止角膜组织 DNA 的合成，故长期使用能损伤角膜上皮，影响溃疡的修复，使用时一般不宜超过 3 周，痊愈后继续使用一般不宜超过 3 ~ 5 日。频繁滴眼可致角膜上皮点状剥脱，且不能避免复发。(4) 缺乏资料，孕妇及哺乳期妇女不宜使用。(5) 儿童用药尚缺乏资料。一般不用于婴幼儿。

【禁忌证】对碘苷及碘制剂过敏的患者。

【不良反应】(1) 有畏光、局部充血、水肿、痒或疼痛等不良反应；也可发生过敏反应眼睑水肿。(2) 长期滴用，可引起接触性皮炎、点状角膜病变、滤泡性结膜炎、泪点闭塞等。

【用法与用量】滴于结膜囊内：1 ~ 2 小时 1 次，一次 1 ~ 2 滴。

【制剂与规格】碘苷滴眼液：① 8 ml : 8 mg；② 10 ml : 10 mg。

阿糖腺苷

Vidarabine

【适应证】用于治疗疱疹病毒感染所致的口炎、皮炎、脑炎及巨细胞病毒感染。

【注意事项】(1) 如注射部位疼痛，必要时可加盐酸利多卡因注射液解除疼痛症状。(2) 孕妇慎用。

【不良反应】不良反应程度与给药量和疗程成正相关。(1) 可见注射部位疼痛。(2) 极少情况下，有出现神经肌肉疼痛及关节疼痛，偶有见血小板减少、白细胞减少或骨髓巨细胞增多现象，停药后可自行恢复，为可逆性，必要时可对症治疗。

【用法与用量】肌内注射或缓慢静脉注射：临用前，每瓶加 2 ml 灭菌生理盐水溶解后，或遵医嘱。用药过程中密切注意不良反应的发生并及时处理。成人：按体重一次 5 ~ 10 mg/kg，一日 1 次。

【制剂与规格】注射用阿糖腺苷：0.2 g。

注射用单磷酸阿糖腺苷：① 0.1 g；② 0.2 g。

酞丁安

Ftibamzone

【适应证】(1) 外用于治疗单纯疱疹、带状疱疹、尖锐湿疣、浅表真菌感染（如体癣、股癣、手足癣等)。(2) 滴眼液治疗各种沙眼、单纯疱疹病毒Ⅰ型与Ⅱ型及水痘-带状疱疹病毒引起的角膜炎。

【注意事项】(1) 软膏剂、搽剂使用时注意勿入口内和眼内。(2) 涂布部位如有灼烧感、瘙痒、红肿等，应停止用药，洗净。必要时向医师咨询。(3) 育龄妇女慎用。(4) 缺乏资料，哺乳期妇女不宜使用。(5) 儿童用药尚缺乏资料。一般不用于婴幼儿。

【禁忌证】对制剂药品中任何成分过敏者和孕妇禁用。

【不良反应】少数病例有局部瘙痒刺激反应，如皮肤红斑、丘疹及刺痒感。

【用法与用量】(1) 软膏剂、搽剂：①单纯疱疹、带状疱疹、尖锐湿疣等，外涂于患处，一日 3 次。②浅表真菌感染，外涂于患处，早晚各一次，体股癣连用 3 周，手足癣连用 4 周。③阴部瘙痒症，涂于患处，一日 2 次，连用 1 周。(2) 滴眼液：滴入眼睑内，一次 1 滴，一日 2 ~ 4 次。

【制剂与规格】酞丁安滴眼液：8 ml : 8 mg。

酞丁安搽剂：5 ml : 25 mg [0.5% (*W/V*)]。

酞丁安软膏：① 10 g : 0.1 g；② 10 g : 0.3 g。

膦甲酸钠[保(乙)]

Foscarnet Sodium

【适应证】(1) 艾滋病患者巨细胞病毒性视网膜炎。(2) 免疫功能损害患者耐阿昔洛韦单纯疱疹病毒性皮肤黏膜感染。

【注意事项】(1) 必须由专科医生严格按使用说明书使用。(2) 用药期间必须密切监测肾功能，根据肾功能情况调整剂量。老年患者应慎用，并在用药前以及用药期间注意监测肾功能状态。(3) 不能采用快速或一次大剂量式静脉注射方式给

药。静脉滴注速度不得大于每分钟 1 mg/kg。(4) 为减低其肾毒性，使用以前及使用期间患者应水化；静脉输液（5% 葡萄糖或生理盐水），一日 2.5 L，并可适当使用噻嗪类利尿药。(5) 不能与其他药物混合静脉滴注，仅能使用 5% 葡萄糖或生理盐水稀释。(6) 不能与其他肾毒性药物如氨基糖苷类抗生素、两性霉素 B 或万古霉素等同时使用。不能与喷他脒联合静脉滴注，以免发生低钙血症。(7) 注射剂避免与皮肤、眼接触，若不慎接触，应立即用清水洗净。(8) 儿童及孕妇有应用指征时需仔细权衡利弊。哺乳期妇女应用时应停止哺乳。(9) 乳膏剂严格限用于免疫功能损害患者耐阿昔洛韦的单纯疱疹病毒性皮肤、黏膜感染。(10) 破损皮肤涂敷乳膏或涂敷面积较大时，应适当减少剂量。乳膏剂用药后如局部刺激症状严重，应立即停药。

【禁忌证】对膦甲酸钠过敏者禁用。

【不良反应】(1) 肾功能损害：血清肌酐值升高，肌酐清除率降低，肾功能异常、急性肾衰竭、尿毒症、多尿、代谢性酸中毒。停止用药 1 ~ 10 周血清肌酐值能恢复至治疗前水平或正常。(2) 电解质紊乱：低钙血症、低镁血症、低钾血症、低磷血症或高磷血症。本品能螯合二价金属离子（Ca^{2+}、Mg^{2+}、Fe^{2+}、Zn^{2+}）。(3) 惊厥（包括癫痫大发作）。(4) 贫血或血红蛋白降低。(5) 局部刺激：注射部位静脉炎，生殖泌尿道刺激症状或溃疡。(6) 全身：疲乏、不适、寒战、发热、脓毒症。(7) 胃肠系统：恶心、呕吐、腹泻、腹痛、消化不良、便秘，曾有胰腺炎个例报道。(8) 代谢及营养失调：低钠血症和下肢水肿，乳酸脱氢酶、碱性磷酸酶或淀粉酶升高。(9) 中枢及周围神经系统：感觉异常、头痛、眩晕、非自主性肌肉收缩、震颤、共济失调、神经病。(10) 精神失调：厌食、焦虑、神经质、精神紊乱、抑郁、精神病、激动、进攻性反应。(11) 肝胆系统：ALT 和 AST 异常。(12) 心血管：ECG 异常、高血压或低血压、室性心律失常。(13) 其他：白细胞减少、粒细胞减少、血小板减少、皮疹、肌肉无力。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：中央静脉插管滴注，注射液（24 mg/ml）可不需稀释，直接使用；周围静脉滴注：必须用 5% 葡萄糖或 0.9% 氯化钠注射液稀释至 12 mg/ml 后使用。①获得性免疫缺乏综合征（AIDS）患者巨细胞病毒性视网膜炎（肾功能正常），诱导治疗：推荐初始剂量为 60 mg/kg，每 8 小时 1 次，滴注时间不得少于 1 小时，根据疗效连用 2 ~ 3 周。维持治疗：维持剂量为一日 90 ~ 120 mg/kg，滴注时间不得少于 2 小时。维持治疗期间，若病情加重，可重复诱导治疗及维持治疗过程。②免疫功能损害患者耐阿昔洛韦单纯疱疹病毒性皮肤黏膜感染，40 mg/kg，每 8 或 12 小时 1 次，滴注时间不得少于 1 小时，连用 2 ~ 3 周或直至治愈。肾功能减退者维持期剂量按表 9-13 调整。单纯疱疹和带状疱疹患者肌肝清除率每分钟低于 96 ml 时，剂量应调整。(2) 外用（乳膏）：适量涂于患处，一日 3 ~ 4 次，5 日为 1 个疗程。

表 9-13 肾功能减退时膦甲酸钠的用量

诱导期	
肌酐清除率（每分钟毫升数）	每 8 小时 1 次的剂量（mg/kg）
90 ~ 95	57
84 ~ 89	53
78 ~ 83	49
72 ~ 77	46
66 ~ 71	42
60 ~ 65	39
54 ~ 59	35
48 ~ 53	32
42 ~ 47	28
36 ~ 41	25
30 ~ 35	25
24 ~ 29	18
维持期	
肌酐清除率（每分钟毫升数）	每 8 小时 1 次的剂量（mg/kg）
72 ~ 78	78
60 ~ 71	75
49 ~ 59	71
36 ~ 48	63
24 ~ 35	57

【制剂与规格】膦甲酸钠注射液：① 100 ml ∶ 2.4 g；② 250 ml ∶ 3 g；③ 250 ml ∶ 6.0 g；④ 500 ml ∶ 6.0 g。

膦甲酸钠0.9%氯化钠注射液：① 100 ml ∶ 2.4g；② 250 ml ∶ 3.0 g。

膦甲酸钠乳膏：① 5g ∶ 0.15g；② 10g ∶ 0.3g。

鬼臼毒素 用于男、女外生殖器及肛门周围部位的尖锐湿疣。外用：①涂药前先用消毒、收敛溶液（如高锰酸钾溶液等）清洗患处、擦干。②用特制药签将药液涂于疣体处，涂遍疣体，不需重复并尽量避免药液接触正常皮肤和黏膜。用药总量勿超过 1 ml，涂药后暴露患处使药液干燥。一日 2 次，连续 3 日，停药观察 4 日为 1 个疗程。如病灶尚有残留可重复 1 个疗程，但最多不超过 3 个疗程。（其他见 16.14.4）

9.7 抗真菌药

9.7.1 真菌感染及其药物治疗

真菌感染可根据真菌侵犯部位分为浅部真菌病和侵袭性真菌病。浅部真菌病指表皮、毛发和甲板的真菌感染。其药物治疗见第 16 章 皮肤科疾病用药。

侵袭性真菌病指侵犯皮肤真皮黏膜和侵袭组织内脏的真菌引起的感染性疾病，近年来由于广泛应用广谱抗生素、皮质激素、免疫抑制药、放射治疗、化学治疗、器官移植、导管手术以及获得性免疫缺陷综合征的增多，而导致侵袭性真菌病日益增加。它需用全身性抗真菌药治疗。

9.7.2 侵袭性真菌病的药物治疗原则

获得性免疫缺陷综合征的机会性真菌感染的药物治疗见 9.6.2.2。

（1）侵袭性念珠菌病（invasive candidosis）：由念珠菌侵犯内脏器官所引起的感染。病源菌主要来自消化道，经功能减弱的肠黏膜屏障而进入血流，可播散至全身。也可由深静脉导管上的菌落释放入血。对深部和播散性的念珠菌感染的治疗：近期未用过唑类抗真菌药且临床情况稳定的念珠菌（光滑和克柔念珠菌除外）感染，首选氟康唑。氟康唑耐药的念珠菌感染，或病情危重，有血流动力学不稳定、器官功能障碍的患者可选用卡泊芬净、伏立康唑或两性霉素 B 与氟胞嘧啶联用。

（2）曲霉菌病（aspergillosis）：曲霉菌主要通过呼吸道侵入机体。除侵犯肺脏外，也可侵犯体内的窦腔、心脏、脑和皮肤。曲霉菌治疗：伏立康唑为首选，也可考虑两性霉素 B（若考虑药物存在不良反应或肾损害时可选择脂质体两性霉素 B）治疗。若患者对两性霉素 B 耐药或不能耐受，卡泊芬净可供选择，联合使用伏立康唑和卡泊芬静是值得推荐的治疗方法，伊曲康唑可在病情不十分严重，且疑似真菌感染的情况早期经验性的使用，或患者确实经济能力有限的，而又对两性霉素 B 以及脂质体两性霉素 B 不能耐受的情况，可以考虑使用。

（3）隐球菌病（cryptococcosis）：隐球菌病是新生隐球菌所致的感染性疾病。隐球菌性脑膜炎是最常见的真菌性脑膜炎，可危及生命。隐球菌性脑膜炎的治疗可选择静脉应用两性霉素 B 联合氟胞嘧啶治疗 2 周后，再口服氟康唑 8 周，或直至培养转阴性。AIDS 患者伴有局限的隐球菌感染，或患者不能耐受两性霉素 B 时，氟康唑可作为替代药物单独应用。免疫缺陷者隐球菌感染控制后，氟康唑可用于预防复发，直至免疫功能恢复。

（4）组织胞浆菌病（histoplasmosis）：伊曲康唑可用于治疗免疫健全者的隐性非脑膜感染，包括慢性肺组织胞浆菌病；酮康唑是免疫健全者的另一种可选药物。对暴发性或严重感染，首选静脉输注两性霉素 B。在感染控制后，伊曲康唑可用于预防复发。免疫缺陷者易发生真菌感染，可能需预防性应用抗真菌药物。口服唑类抗真菌药是预防用药的选择。氟康唑比伊曲康唑和酮康唑更易于吸收，毒性较酮康唑小。

9.7.3 真菌病及其药物治疗

9.7.3.1 念珠菌病（candidosis）的药物治疗

近年有白色念珠菌感染减少，非白色念珠菌感染有增多的趋势，后者对氟康唑

的敏感性有所下降。光滑念珠菌或克柔念珠菌感染，应避免使用氟康唑。

(1) 口腔炎、食管炎（非 AIDS 患者）

◆ 可能病原菌：白念珠菌。

◆ 首选抗真菌药：氟康唑，口服一次 200 mg，一日 1 次，连续 14 日；或伊曲康唑，口服一次 200 mg，一日 1 次，空腹服用，连续 7 日。

◆ 备选抗真菌药：克霉唑，一次 10 mg，一日 5 次；或制霉菌素一次 20 万～40 万 U，一日 5 次，口含或吞服，连续 14 日。食管炎可用伏立康唑一次 4 mg/kg，一日 2 次口服或静脉滴注；或两性霉素 B，一日 0.3 mg/kg，静脉滴注。

◆ 说明：不用维持量，常在治疗 3～4 日后病情改善，延长治疗可减少复发。氟康唑耐药念珠菌可用卡泊芬净，一日 50 mg，静脉滴注。

(2) 外阴阴道炎

◆ 可能病原菌：白念珠菌。

◆ 抗真菌药：局部用制霉菌素阴道片剂，一日 1 万 U，连续 14 日。氟康唑 150 mg，口服，一次。伊曲康唑，口服，一次 200 mg，一日 2 次，或一次 200 mg，一日 1 次，连续 3 日。

◆ 说明：口服和阴道内给药同样有效，避免穿紧身衣裤，口服药物可减少复发。

(3) 侵袭性念珠菌病

①念珠菌性血流感染（血流动力学稳定，伴有或不伴深静脉导管，器官功能正常，30 日内未用过三唑类药，非光滑念珠菌或克柔念珠菌感染者）

◆ 首选抗真菌药：氟康唑静脉注射，一日 6 mg/kg 或 400 mg，一日 1 次，或口服一日 1 次，连续 7～14 日；也可氟康唑静脉注射首次 400 mg，一日 1 次，继以一次 200 mg，一日 1 次，依据病情和症状可增至一日 400 mg，后以氟康唑口服替代序贯治疗，直至末次血培养阴性，临床感染症状和体征均消失后再继续使用 14 日。

◆ 备选抗真菌药：卡泊芬净静脉注射，第 1 日 70 mg，后改为一日 50 mg（肝功能中度受损者减到一日 35 mg）；或米卡芬净静脉注射，一次 100 mg，一日 1 次；肝、肾功能不全者不需要调整剂量。

◆ 说明：血培养阳性者均需用药治疗。有深静脉置管者，首先拔除或更换深静脉导管，不要在导丝引导下更换。

②念珠菌性血流感染（血流动力学不稳定，或有 1 个或 1 个以上器官功能不正常；静脉导管已经拔除；光滑念珠菌或克柔念珠菌感染；曾用氟康唑治疗；中性粒细胞持续降低者）

◆ 首选抗真菌药：卡泊芬净静脉注射，第 1 日 70 mg，以后一日 50 mg，（肝功能中度受损者减少到一日 35 mg）；或米卡芬净静脉注射，一次 100 mg，一日 1 次。对肝、肾功能不全者不需要调整剂量。

◆ 备选抗真菌药：两性霉素 B 静脉注射，一日 0.7 mg/kg，一日 1 次（光滑念珠菌感染，一日 >0.7 mg/kg，克柔念珠菌感染一日 1 mg/kg）；或脂质体两性霉素 B 静脉注射，一日 3～5 mg/kg；或伏立康唑：第一日 6 mg/kg，每 12 小时 1 次，以后 3 mg/kg，每 12 小时 1 次，维持至少在 3 日以上才可考虑更换口服治疗。联合治疗：氟康唑，一日 800 mg 加两性霉素 B 静脉注射，一日 0.7 mg/kg，用于最初的 5～6 日，后改为口服氟康唑序贯治疗，一次 400 mg，一日 1 次。

◆ 说明：由于唑类抗真菌药之间可有交叉耐药，过去使用唑类药较为普遍，故不推荐首选伏立康唑。可选用氟康唑，一日 800 mg，加两性霉素 B，一日 0.7 mg/kg 联合治疗重症念珠菌血症。

③支气管、肺念珠菌病

◆ 首选抗真菌药：同①②。

◆ 备选抗真菌药：同①②。

④念珠菌性心内膜炎

◆ 可能病原菌：白色念珠菌，非白色念珠菌属，曲霉菌属，其他真菌。

◆ 首选抗真菌药：两性霉素 B 静脉注射，一日 0.6 mg/kg，连续 7 日，然后一日 0.8 mg/kg，隔日一次。或手术切除病灶后用脂质体两性霉素 B，3～5 mg/kg，6～8 周，加氟胞嘧啶口服，一次 25～37.5 mg/kg，一日 4 次。

◆ 备选抗真菌药：氟康唑，口服一日 200～400 mg，用于慢性维持治疗可能有效。

◆ 说明：早期诊断是治疗成功的重要

前提。

9.7.3.2 曲霉菌病药物治疗

烟曲霉常见，其次是黄曲霉及其他真菌，其中土曲霉菌对两性霉素 B 不敏感。

(1)过敏性支气管肺曲霉菌病(ABPA)

◆ 药物治疗：ABPA 常有哮喘症状，可以考虑皮质激素治疗。抗真菌药用伊曲康唑，200 mg，口服，一日 1 次，持续 16 周或更长。

◆ 说明：并用伊曲康唑能降低皮质激素的用量。曲霉球菌。药物治疗疗效尚未证实，伊曲康唑可能有益，第一日 200 mg，静脉注射，每 12 小时 1 次。维持剂量 200 mg，静脉注射，一日 1 次，或口服，一次 200 mg，每 12 小时 1 次。根据患者的不同病情，治疗不尽相同。可采用临床观察、药物治疗和(或)手术切除。手术切除是唯一的根治方法，适用于反复咯血或存在影响预后危险因素的患者。

(2) 急性侵袭性肺曲霉病或肺外曲霉病

◆ 首选抗真菌药：伏立康唑静脉注射，第 1 日 6 mg/kg，每 12 小时 1 次。维持量 4 mg/kg，每 12 小时 1 次；或体重 ≥ 40 kg 者一次 200 mg，口服，每 12 小时 1 次，体重 < 40 kg 者 100 mg，口服，每 12 小时 1 次。或质脂体两性霉素 B（ABLC），它与普通两性霉素 B 等效，而肾毒性小，但价格昂贵。如果患者在用伏立康唑 7 ~ 10 日无反应，则可以改用脂质体两性霉素 B 或两性霉素 B；快速增至一日 1 mg/kg，静脉注射，一日 1 次（一日 1 ~ 1.25 mg/kg，静脉注射，一日 1 次。如中性粒细胞减少者）。联合治疗：伏立康唑（剂量同上）+ 卡泊芬净（剂量见后）。

◆ 备选抗真菌药：上述治疗效果不佳时可以使用卡泊芬净：第 1 日，70 mg，静脉注射，以后改为 50 mg，（肝功能中毒受损者减少到一日 35 mg，一日 1 次），所有治疗方案如有效，2 ~ 3 周后可改为伏立康唑口服。

◆ 说明：伏立康唑对颅内的曲霉菌病治疗效果较好，对复发的感染治疗同样有效。对于两性霉素 B 耐药的土曲霉菌，推荐使用伏立康唑。

◆ 联合治疗：三唑类（伏立康唑、伊曲康唑）、棘白菌素类（卡泊芬净、米卡芬净）和两性霉素 B 之间无拮抗作用。

9.7.3.3 隐球菌病的药物治疗

(1) 隐球菌脑膜炎（cryptococcal meningitis）（非 AIDS 患者）

◆ 首选抗真菌药：两性霉素 B 静脉注射，一次 0.5 ~ 0.8 mg/kg，一日 1 次，加氟胞嘧啶口服，一次 25 ~ 37.5 mg/kg，每 6 小时 1 次，至患者退热及病原菌阴性（约 6 周），后改用氟康唑口服，一次 200 mg，一日 1 次。对轻症可用口服氟康唑一次 400 mg，一日 1 次，连续 8 ~ 10 周。

◆ 说明：脑积水可用导管行脑室腹膜腔分流或脑室心房分流术。

(2) 肺隐球菌病（pulmonary cryptococcosis）或隐球菌性血流感染（非 AIDS，非脑膜炎）

◆ 首选抗真菌药：病情较严重者，两性霉素 B 静脉注射，一日 0.5 ~ 0.8 mg/kg，至病情好转后改用氟康唑口服，一次 400 mg，一日 1 次，连续 8 ~ 10 周。病情较轻者可用氟康唑，静脉注射或口服，一日 400 mg，连续 8 周至 6 个月。

◆ 备选抗真菌药：伊曲康唑，口服一次 200 ~ 400 mg，一日 1 次，连续 6 ~ 12 个月。或两性霉素 B 静脉注射，一日 0.3 mg/kg，加氟胞嘧啶口服，一次 37.5 mg/kg，一日 3 次，连续 6 周。

◆ 说明：单用氟康唑治疗脑膜炎和非脑膜型隐球菌病 90% 有效。氟康唑治疗和两性霉素 B 的效果相同。对治疗失败的病例，用干扰素加脂质体两性霉素 B。

9.7.3.4 青霉病（penicilliosis，马纳非青霉菌）的药物治疗

◆ 首选抗真菌药：两性霉素 B 静脉注射，一日 0.5 ~ 1 mg/kg，连续 2 周，继以伊曲康唑口服，一日 400 mg，连续 10 周；然后一日 200 mg，AIDS 感染者需长期服用。

◆ 备选抗真菌药：轻症患者可口服伊曲康唑，一次 200 mg，一日 3 次，连续 3 日；然后一次 200 mg，一日 2 次，连续 12 周，接着一次 200 mg，一日 1 次，视病情和

真菌清除情况决定疗程（不能口服者可改用静脉给药）。

◆ 说明：青霉菌是东南亚 AIDS 患者仅次于结核和隐球菌脑膜炎的第三种最常见的机会菌感染。长期服用伊曲康唑可有效防止复发。

9.7.3.5 组织胞浆菌病(夹膜组织胞浆菌)肺组织胞浆菌病（免疫功能正常者）

◆ 抗真菌药治疗：①轻度：可无需治疗。②中度：伊曲康唑口服，一日 200 mg，连续 9 个月，如有生命危险口服 200 mg，一日 3 次，3 日，然后 200 mg，一日 2 次，直至好转；或伊曲康唑一次 200 mg，静脉注射，一日 2 次，连续 3 日，然后 200 mg，静脉注射，一日 1 次。③重度（包括脑膜炎）：脂质体两性霉素 B，一日 4 mg/kg，静脉注射，7 日，然后 0.8 mg/kg，隔日 1 次，静脉注射，至总剂量达到 1 g，然后换用伊曲康唑一日 200 mg，9 个月。伊曲康唑不推荐用于脑膜炎。

◆ 说明：慢性肺内和肺外的组织胞浆菌病用伊曲康唑治疗 2 个月成功率 86%；脑膜炎很难治疗。推荐使用脂质体两性霉素 B 是因为脑脊液中的浓度比两性霉素 B 者为高。氟康唑疗效不如伊曲康唑。

9.7.3.6 诺卡放线菌病（nocadiosis）(星状诺卡菌，巴西诺卡菌）的药物治疗

（1）皮肤和皮肤淋巴结诺卡菌病

◆ 首选抗菌药物：甲氧苄啶和磺胺甲噁唑：甲氧苄啶一日 5 ~ 10 mg/kg，磺胺甲噁唑 25 ~ 50 mg/kg，分 2 ~ 4 次口服或静脉注射。口服磺胺异噁唑一次 2 g，一日 4 次；或口服米诺环素一日 100 ~ 200 mg，一日 2 次。

◆ 说明：有报道口服利奈唑胺，一次 300 ~ 600 mg，一日 2 次，3 ~ 24 个月治疗成功。

（2）肺部、播散性、脑诺卡菌病（脑脓肿）

◆ 首选抗菌药物：开始甲氧苄啶一日 15 mg/kg，磺胺甲噁唑 75 mg/kg，分 2 ~ 4 次口服或静脉滴注，3 ~ 4 周后，甲氧苄啶减量至一日 10 mg/kg，分 2 ~ 4 次口服。

◆ 备选抗菌药物：亚胺培南，500 mg 每 6 小时 1 次，静脉注射，联合应用阿米卡星 7.5 mg/kg，静脉注射，每 12 小时 1 次，持续 3 ~ 4 周。继以口服方案序贯治疗。

◆ 说明：免疫功能正常者的疗程一般为 3 个月；免疫受损者如器官移植、恶性肿瘤、慢性肺部疾病、糖尿病、用皮质激素治疗的患者，疗程为 6 个月。

9.7.3.7 肺孢子菌病（pneumocytosis carniipneumonia）(肺孢子菌肺炎）

(1) 非急性感染(能口服药物，PaO_2 > 70 mmHg)

◆ 首选抗菌药物：复方磺胺甲噁唑片口服，一次 4 片，每 8 小时 1 次，连续 21 日；或氨苯砜口服，一次 100 mg，每 24 小时 1 次，联合应用甲氧苄啶 5 mg/kg，一日 3 次，疗程 21 日。AIDS 患者还需接受肺孢子菌病的慢性治疗。

◆ 备选抗菌药物：克林霉素一次 300 ~ 450 mg，每 6 小时 1 次，口服加伯氨喹，一次 15 mg（基质）每 24 小时 1 次，口服；或阿托伐醌一次 750 mg，一日 2 次，与食物同服。疗程均为 21 日。

(2) 急性感染(不能口服给药，PaO_2 < 70 mmHg)。

◆ 首选抗菌药：在使用复方磺胺甲噁唑（SMZ/TMP）前 15 ~ 30 分钟给予泼尼松口服，一次 40 mg，一日 2 次，连续 5 日，继以 40 mg，每 24 小时 1 次，连续 5 日，再继以 20 mg，每隔 24 小时 1 次，连续 11 日加 SMZ/TMP 一日 TMP15 ~ 20 mg/kg 和 SMZ 75 ~ 100 mg/kg，分 3 ~ 4 次静脉滴注，连续 21 日。

◆ 备选抗菌药：泼尼松（同上）加克林霉素 600 mg，每 8 小时 1 次，静脉注射加伯氨喹（基质）30 mg，每 24 小时一次口服，或泼尼松（剂量同前）加喷他脒一日 4 mg/kg 静脉注射，疗程均为 21 日。

◆ 说明：至少治疗 4 ~ 8 日后，才宜判断是否 SMZ/TMP 治疗失败而改用克林霉素加伯氨喹或喷他脒。21 日后，AIDS 患者还需接受肺孢子菌病慢性抑制

治疗。

(3) 初始预防和治疗后预防

◆ 首选抗菌药物：口服SMZ/TMP片，一次2片，一日1次；或口服氨苯砜，一次100 mg，一日1次，如CD4>200/μl，并持续3个月，方可考虑停药。

◆ 备选药：喷他脒，300 mg加6 ml蒸馏水雾化吸入，每4周1次，或口服氨苯砜200 mg，加乙胺嘧啶75 mg，加服亚叶酸钙，一次25 mg，一周1次；或阿托伐醌1 500 mg，与食物同服。

9.7.3.8 芽生菌病（blastomycosis）（皮炎芽生菌）

皮肤、肺、肺外皮炎芽生菌病

◆ 首选抗真菌药：伊曲康唑，口服，一次100 ~ 200 mg，一日1 ~ 2次，连续6个月；或两性霉素B，静脉滴注，一日0.7 ~ 1 mg/kg，至总剂量≥1.5 g。用于治疗重患者。

◆ 备选抗真菌药：氟康唑口服一日200 mg，最大一日400 mg，至少6个月。

9.7.3.9 镰孢霉菌病

眼、皮肤、鼻旁窦和播散性镰孢霉菌病（fusaridosis）（在骨髓抑制和肿瘤患者中感染机会增加）

◆ 首选抗真菌药：伏立康唑第一日一次6 mg/kg，每12小时1次。然后，体重≥40 kg者一次4 mg/kg，每12小时1次，静脉注射或一次200 mg，口服，一日2次；体重<40 kg者一次100 mg，每12小时1次。

◆ 备选抗真菌药：两性霉素B，1 ~ 1.2 mg/kg；或脂化的两性霉素B；或泊沙康唑口服，一次400 mg，一日2次，进餐时服用（如不进餐时，一次200 mg，一日4次）。

9.7.3.10 毛霉菌病（mucormycosis）（接合菌病-根霉菌属、根毛霉属、犁头霉属）

鼻脑型毛霉菌病（肺毛霉菌病临床以根霉属最常见，可侵及全身。治疗成功的关键是早期诊断。应及早进行组织培养和图片染色。

◆ 首选抗真菌药：两性霉素B，剂量快速增长至一日0.8 ~ 1.5 mg/kg静脉注射。症状改善后可以改为隔日1次，总剂量通常2.5 ~ 3.0 g。如果不能耐受普通两性霉素B或需长时间使用，也可用脂质体两性霉素B，或泊沙康唑一次200 mg，一日4次。

◆ 说明：痊愈取决于：①外科清创；②控制糖尿病，纠正粒细胞减少，或减停免疫抑制药物；③抗真菌药物：长时间应用脂质体两性霉素B或有显著的效果。

两性霉素B [保(乙)]

Amphotericin B

【适应证】用于敏感真菌所致的深部真菌感染且病情呈进行性发展者，如败血症、心内膜炎、脑膜炎（隐球菌及其他真菌）、腹腔感染（包括与透析相关者）、肺部感染、尿路感染和眼内炎等。

【注意事项】(1) 本品毒性大，不良反应多见，但它又是治疗危重深部真菌感染的唯一有效药物，选用时必须权衡利弊后作出决定。总的来说，其含脂复合制剂因具有特有的药动学特性而其毒性有所降低。因此，其含脂复合制剂适用于不能耐受注射用两性霉素B引起的肾毒性、或出现严重毒性反应的患者。其中两性霉素B胆固醇复合体（ABCD）尚适用于粒细胞缺乏患者发热疑为真菌感染的经验治疗。(2) 下列情况应慎用：①肾功能重度减退时，其半衰期仅轻度延长。肾功能轻、中度损害的患者如病情需要仍可选用；重度肾功能损害者则需延长给药间期或减量应用，应用其最小有效量。老年人减量慎用。当治疗累积剂量大于4 g时，可引起不可逆性肾功能损害。②可致肝毒性，肝病患者避免应用本品。(3) 治疗期间定期严密随访血、尿常规、肝、肾功能、血钾、心电图等，如血尿素氮或血肌酐明显升高时，则需减量或暂停治疗，直至肾功能恢复。(4) 为减少不良反应，给药前可给非类固醇抗炎药和抗组胺药，如吲哚美辛和异丙嗪等，同时给予琥珀酸氢化可的松25 ~ 50 mg或地塞米松2 ~ 5 mg一同静脉滴注。(5) 中断治疗7日以上者，需重新自小剂量（0.25 mg/kg）开始逐渐增

加至所需量。(6) 本品宜缓慢避光滴注，每剂滴注时间至少6小时。(7) 药液静脉滴注时应避免外漏，因其可致局部刺激。(8) 用于治疗患全身性真菌感染的孕妇，对胎儿无明显影响。但孕妇用药尚缺乏有良好对照的研究。孕妇如确有应用指征时方可慎用。(9) 哺乳期妇女应避免应用或于用药时暂时停止哺乳。(10) 儿童静脉及鞘内给药剂量以体重计算均同成人，应限用最小有效剂量。

【禁忌证】对两性霉素B过敏及严重肝病患者禁用。

【不良反应】(1) 静脉滴注过程中或静脉滴注后发生寒战、高热、严重头痛、食欲缺乏、恶心、呕吐，有时可出现血压下降、眩晕等。(2) 几乎所有患者在疗程中均可出现不同程度的肾功能损害，尿中可出现红细胞、白细胞、蛋白和管型、血尿素氮和肌酐增高，肌酐清除率降低，也可引起肾小管性酸中毒。(3) 低钾血症。(4) 血液系统毒性反应有正常红细胞性贫血，偶可有白细胞或血小板减少。(5) 肝毒性，较少见，可致肝细胞坏死，急性肝衰竭亦有发生。(6) 静脉滴注过快时可引起心室颤动或心搏骤停。电解质紊乱亦可导致心律失常。滴注时易发生血栓性静脉炎。(7) 鞘内注射可引起严重头痛、发热、呕吐、颈项强直、下肢疼痛及尿潴留等，严重者可发生下肢截瘫等。(8) 过敏性休克、皮疹等变态反应偶有发生。

【用法与用量】(1) 注射用两性霉素B (AMB)：①静脉滴注，静脉滴注液的配制方法为先以灭菌注射用水10 ml配制本品50 mg (或以5 ml配制25 mg) 然后用5%葡萄糖注射液稀释 (不可用0.9%氯化钠注射液，因可产生沉淀)，滴注液的药物浓度不超过10 mg/100 ml，避光缓慢静滴，一次滴注时间需6小时以上，稀释用葡萄糖注射液的pH应在4.2以上。开始时先试以1～5 mg或按体重一次0.02～0.1 mg/kg给药，以后根据患者耐受情况一日或隔日增加5mg，当增至一次0.6～0.7 mg/kg时即可暂停增加剂量，此为一般治疗量。成人最高一日不超过1 mg/kg，一日或间隔1～2日1次，累积总量1.5～3.0 g，疗程1～3个月，也可长至6个月，视病情及疾病种类而定。对敏感真菌感染宜采用较小剂量，即成人一次20～30 mg，疗程同上。②鞘内给药，首次0.05～0.1 mg，以后渐增至一次0.5 mg，最大量一次不超过1 mg，一周给药2～3次，总量15 mg左右。鞘内给药时宜与小剂量地塞米松或琥珀酸氢化可的松同时给予，并需用脑脊液反复稀释药液，边稀释边缓慢注入以减少不良反应。鞘内注射的配制方法：先以灭菌注射用水10 ml配制本品50 mg (或5 ml配制25 mg) 然后取5 mg/ml浓度的药液1 ml，加5%葡萄糖注射液19 ml稀释，使最终浓度成250 μg/ml。注射时取所需药液量以脑脊液5～30 ml反复稀释，并缓慢注入。鞘内注射液的药物浓度不可高于25 mg/100 ml，pH应在4.2以上。③局部用药：气溶吸入时成人一次5～10 mg，用灭菌注射用水溶解成0.2%～0.3%溶液应用；超声雾化吸入时本品浓度为0.01%～0.02%，一日吸入2～3次，一次吸入5～10 ml；持续膀胱冲洗时一日以两性霉素B 5 mg加入1 000 ml灭菌注射用水中，按每小时注入40 ml速度进行冲洗，共用5～10日。(2) 两性霉素B脂质体 (AMBL)：静脉滴注，起始剂量一日0.1 mg/kg。用注射用水稀释溶解并振荡摇匀后加至5%葡萄糖500 ml内静脉滴注。滴速不得超过每分钟30滴，观察有无不适，前2小时每小时监测体温、脉搏、呼吸、血压各1次。如无不良反应，第2日开始增加一日0.25～0.50 mg/kg，剂量逐日递增至维持剂量：一日1～3 mg/kg。输液浓度已不大于0.15 mg/ml为宜。中枢神经系统感染，最大剂量1 mg/kg给药前可考虑合并用地塞米松，以减少局部反应，但应注意皮质激素有引起感染扩散的可能。疗程视病种病情而定。

【制剂与规格】注射用两性霉素B：①5 mg (5 000 U)；②25 mg (2.5万U)；③50 mg (5万U)。

注射用两性霉素B脂质体 (AMBL)：①2 mg (2 000 U)；②10 mg (1万U)；③50 mg (5万U)；④100 mg (10万U)。

氟康唑[基(基), 保(乙)]

Fluconazole

【适应证】(1) 念珠菌病：口咽部和食管念珠菌感染；播散性念珠菌病，包括腹膜炎、肺炎、尿路感染等；念珠菌外阴阴道炎。骨髓移植患者接受细胞毒类药物或放射治疗时，预防念珠菌感染的发生。(2) 隐球菌病：治疗脑膜炎以外的新型隐球菌病或治疗隐球菌脑膜炎时，作为两性霉素B联合氟胞嘧啶初治后的维持治疗药物。(3) 球孢子菌病。(4) 接受化疗、放疗和免疫抑制治疗患者的预防治疗。(5) 可替代伊曲康唑用于芽生菌病和组织胞浆菌病的治疗。

【注意事项】(1) 与其他吡咯类药物可发生交叉过敏反应，因此对任何一种吡咯类药物过敏者都应禁用氟康唑。(2) 需定期监测肝肾功能，用于肝肾功能减退者需减量应用。(3) 在免疫缺陷者中的长期预防用药，已导致念珠菌属等对氟康唑等吡咯类抗真菌药耐药性的增加，应避免无指征预防用药。(4) 治疗过程中可发生轻度一过性AST及ALT升高，偶可出现肝毒性症状。治疗前后均应定期检查肝功能，如出现持续异常或肝毒性临床症状时均需立即停用。(5) 与肝毒性药物合用、需服用氟康唑2周以上或接受多倍于常用剂量的本品时，可使肝毒性的发生率增高，需严密观察。(6) 疗程应视感染部位及个体治疗反应而定。一般治疗应持续至真菌感染的临床表现及实验室检查指标显示真菌感染消失为止。隐球菌脑膜炎或反复发作口咽部念珠菌病的艾滋病患者需用氟康唑长期维持治疗以防止复发。(7) 接受骨髓移植者，如严重粒细胞减少已先期发生，则应预防性使用，直至中性粒细胞计数上升至1.0×10^9/L以上后7日。(8) 哺乳期妇女慎用或服用时暂停哺乳。(9) 对小儿的影响缺乏充足的研究资料，小儿不宜应用。(10) 老年患者须根据肌酐清除率调整剂量。

【禁忌证】对氟康唑或其他吡咯类药有过敏史者和孕妇禁用。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、腹痛或腹泻等。(2) 过敏反应，可表现为皮疹，偶可发生严重的剥脱性皮炎（常伴随肝功能损害）、渗出性多形红斑。(3) 肝毒性，治疗过程中可发生轻度一过性AST及ALT升高，偶可出现肝毒性症状，尤其易发生于有严重基础疾病（如艾滋病和癌症）的患者。(4) 可见头晕、头痛。(5) 某些患者，尤其有严重基础疾病（如艾滋病和癌症）的患者，可能出现肾功能异常。(6) 偶可发生周围血象一过性中性粒细胞减少和血小板减少等血液学检查指标改变，尤其易发生于有严重基础疾病（如艾滋病和癌症）的患者。

【用法与用量】口服或静脉滴注：静脉滴注时，最大速率为每小时200 mg，且容量不超过每分钟10 ml。(1) 成人：①播散性念珠菌病，首次剂量0.4g，以后一次0.2g，一日1次，持续4周，症状缓解后至少持续2周。②食管念珠菌病，首次剂量0.2g，以后一次0.1g，一日1次，持续至少3周，症状缓解后至少持续2周。根据治疗反应，也可加大剂量至一次0.4g，一日1次。③口咽部念珠菌病，首次剂量0.2g，以后一次0.1g，一日1次，疗程至少2周。④念珠菌外阴阴道炎，单剂量0.15g。⑤隐球菌脑膜炎，一次0.4g，一日1次，直至病情明显好转，然后一次0.2～0.4g，一日1次，用至脑脊液病毒培养转阴后至少10～12周。或一次0.4g，一日2次，连续2日，然后一次0.4g，一日1次，疗程同前述。(2) 肾功能不全者：若只需给药1次，不用调节剂量；需多次给药时，第1日及第2日应给常规剂量，以此后按肌酐清除率来调节给药剂量：肌酐清除率＞50%者，按常规剂量的100%用药；11%～50%（未透析）者，按常规剂量的50%用药；定期透析患者，一次透析后应用按常规剂量的100%用药。

【制剂与规格】氟康唑片：① 50 mg；② 100 mg；③ 150 mg；④ 200 mg。

氟康唑胶囊：① 50 mg；② 100 mg；③ 150 mg。

氟康唑注射液：① 50 ml：100 mg；② 100 ml：200 mg。

伊曲康唑[保(乙)]

Itraconazole

【适应证】(1) 妇科：外阴及阴道念珠菌病。(2) 皮肤科／眼科：花斑癣、皮肤真菌病、真菌性角膜炎和口腔念珠菌病。(3) 皮肤真菌和（或）酵母菌引起的甲真菌病。(4) 系统性真菌感染：系统性曲霉病及念珠菌病、隐球菌病（包括隐球菌性脑膜炎）、组织胞浆菌病、孢子丝菌病、巴西副球孢子菌病、芽生菌病和其他各种少见的系统性或热带真菌病。

【注意事项】(1) 对持续用药超过1个月者，及治疗过程中如出现厌食、恶心、呕吐、疲劳、腹痛或尿色加深的患者，建议检查肝功能。如果出现异常，应停止用药。(2) 肝功能异常患者慎用（除非治疗的必要性超过肝损伤的危险性）。肝硬化患者，使用时应考虑调整剂量，并监测肝酶。(3) 当发生神经系统症状时应终止治疗。(4) 对肾功能不全患者，患者肌酐清除率每分钟 <30 ml 时，不得使用静脉给药。(5) 对有充血性心力衰竭危险因素的患者，应谨慎用药，并严密监测。对患有充血性心力衰竭或有充血性心力衰竭病史的患者，应权衡利弊使用。脏病；严重的肺部疾病，如慢性阻塞性肺病；肾衰竭和其他水肿性疾病。(6) 钙通道阻滞药具有负性肌力作用，合并使用时需加注意。(7) 如果发生可能与伊曲康唑注射液有关的神经病变时，应当停药。(8) 对其他唑类药物过敏的患者使用伊曲康唑注射液时应慎重。(9) 伊曲康唑注射液只能用随包装提供的 50 ml 0.9% 氯化钠注射液稀释。(10) 孕妇禁用（除非用于系统性真菌病治疗，但仍应权衡利弊）。(11) 哺乳期妇女不宜使用。(12) 育龄妇女使用时应采取适当的避孕措施，直至停止依曲康唑治疗后的下一个月经周期。(13) 儿童的临床资料有限，不用于儿童患者，除非潜在利益优于可能出现的危害。(14) 用于老年人的临床资料有限，用于老年人时需权衡利弊。

【禁忌证】(1) 禁用于已知对伊曲康唑及辅料过敏的患者。(2) 注射液禁用于不能注射 0.9% 氯化钠注射液的患者。(3) 注射液禁用于肾功能损伤患者肌酐清除率每分钟＜ 30 ml 者。(4) 禁止与特非那定、阿司咪唑、咪唑斯汀、西沙必利、多非利特、奎尼丁、匹莫齐特、口服咪达唑仑、经 CYP3A4 代谢的羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药如洛伐他汀或辛伐他汀等合用。

【不良反应】(1) 常见厌食、恶心、腹痛和便秘。较少见的副作用包括头痛、可逆性 ALT 及 AST 升高、月经紊乱、头晕和过敏反应（如瘙痒、红斑、风团和血管性水肿）。有个例报告出现 Stevens-Johnson 综合征（重症多形型红斑）。(2) 已有潜在病理改变并同时接受多种药物治疗的大多数患者，长疗程治疗时可见低钾血症、水肿、肝炎和脱发等症状。

【用法与用量】口服：用餐后立即给药。胶囊必须整吞。(1) 局部感染：①念珠菌性阴道炎，一次 200 mg，一日 2 次；疗程 1 日。或一次 200 mg，一日 1 次，疗程 3 日。②花斑癣，一次 200 mg，一日 1 次，疗程 7 日。③皮肤真菌病，一次 100 mg，一日 1 次，疗程 15 日。高度角化区，如足底部癣、手掌部癣需延长治疗 15 日，一日 100 mg。④口腔念珠菌病，一次 100 mg，一日 1 次，疗程 15 日。一些免疫缺陷患者如白血病、艾滋病或器官移植患者，伊曲康唑的口服生物利用度可能会降低，因此剂量可加倍。⑤真菌性角膜炎，一次 200 mg，一日 1 次，疗程 21 日。⑥甲真菌病，一次 200 mg，一日 1 次，疗程 3 个月。本品从皮肤和甲组织中清除比血浆慢，因此，对皮肤感染来说，停药后 2 ～ 4 周达到最理想的临床和真菌学疗效，对甲真菌病来说在停药后 6 ～ 9 个月达到最理想的临床和真菌学疗效。(2) 系统性真菌病：①曲霉病，一次 200 mg，一日 1 次，疗程 2 ～ 5 个月。对侵袭性或播散性感染的患者增加剂量至：一次 200 mg 一日 2 次。②念珠菌病，一次 100 ～ 200 mg，一日 1 次，疗程 3 周～ 7 个月。③非隐球菌性脑膜炎，一次 200 mg，一日 1 次，疗程 2 个月至 1 年维持治疗，(脑膜感染患者）一日 1 次。④隐球菌性脑膜炎，一次 200 mg，一日 2 次，2 个月至 1 年。⑤组织胞浆菌病，一次 200 mg，一日

1次；一次200 mg，一日2次，疗程8个月。⑥孢子丝菌病，一次100 mg，一日1次，疗程3个月。⑦副球孢子菌病，一次100 mg，一日1次，疗程6个月。⑧着色芽生菌病，一次100～200 mg，一日1次；疗程6个月。⑨芽生菌病，一次100 mg，一日1次；或一次200 mg，一日2次，疗程6个月。(3) 危及生命的感染可静脉滴注：先滴注一次200 mg，一日2次，共4次；以后一次200 mg，一日1次。应尽快将静脉滴注改为口服用药。用随包装提供的50 ml 0.9%氯化钠注射液稀释，稀释后的伊曲康唑注射液应立即使用，并且避免阳光直接照射：将滴速调节到每分钟1 ml(每分钟大约25 滴)。在大约1小时的时间里将60 ml溶液滴入患者体内。静滴后应用15～20 ml 0.9%氯化钠注射液冲洗输注管道，以避免残留的伊曲康唑和以后可能用这根导管来输注的其他药物之间发生反应。冲洗过程应进行30 秒至15分钟。

【制剂与规格】伊曲康唑胶囊：0.1 g。
伊曲康唑口服液：150 ml：1.5 g。
伊曲康唑注射液：25 ml：0.25 g。

伏立康唑[保(乙)]

Voriconazole

【适应证】(1) 侵袭性曲霉病。(2) 非中性粒细胞减少患者的念珠菌血症。(3)对氟康唑耐药的念珠菌引起的严重侵袭性感染（包括克柔念珠菌）。(4) 由足放线病菌属和镰刀菌属引起的严重感染。(5) 应主要用于治疗进展性、可能威胁生命的感染患者。

【注意事项】(1) 已知对其他唑类药物过敏者慎用。(2) 极少数使用者发生了尖端扭转性室性心动过速，伴有心律失常危险因素的患者需慎用。(3) 治疗前或治疗期间应监测血电解质，如有电解质紊乱应及时纠正。(4) 连续治疗超过28日者，需监测视觉功能，包括视敏度、视力范围以及色觉。(5) 伴有严重基础疾病（主要为恶性血液病）的患者可发生肝毒性反应。肝脏反应，包括肝炎和黄疸，可以发生在无其他确定危险因素的患者中。停药后即能好转。治疗前及治疗中需检查肝功能，以防发生更严重的肝脏损害。一旦发生应考虑停药。轻度到中度肝硬化者(Child-Pugh A和B) 的负荷剂量不变，但维持剂量减半。严重肝功能不全的患者应用本品时必须权衡利弊，并密切监测药物的毒性反应。(6) 片剂应在餐后或餐前至少1小时服用，其中含有乳糖成分，先天性的半乳糖不能耐受者、Lapp乳糖酶缺乏或葡萄糖－半乳糖吸收障碍者不宜应用片剂。(7) 可能引起视觉改变，包括视物模糊和畏光，使用期间应避免从事有潜在危险性的工作，例如驾驶或操纵机器。(8) 在治疗中患者出现皮疹需严密观察，如皮损进一步加重则需停药。用药期间应避免强烈的、直接的阳光照射。(9) 用药期间必须监测肾功能（主要为血肌酐)。中度到严重肾功能减退（肌酐清除率每分钟＜50 ml) 的患者应用注射液时，可能发生助溶剂SBECD蓄积。除非应用静脉制剂的利大于弊，否则应选用口服给药。肾功能障碍者静脉给药时必须密切监测血肌酐水平，如有升高应考虑改为口服给药。(10) 伏立康唑可经血液透析清除，清除率为每分钟121 ml。4小时的血液透析仅能清除少许药物，无需调整剂量。(11) 在用药期间妊娠，应告知患者本品对胎儿的潜在危险。(12) 哺乳期妇女和儿童患者应慎用，如果使用一定要权衡利弊。(13) 禁止与CYP3A4底物如特非那定、阿司咪唑、西沙必利、匹莫齐特或奎尼丁合用，因为伏立康唑可使上述药物的血浓度增高，从而导致QT间期延长，并且偶见尖端扭转性室性心动过速。

【禁忌证】已知对伏立康唑或任何一种赋形剂有过敏史者、孕妇禁用。

【不良反应】(1) 常见视觉障碍、发热、皮疹、恶心、呕吐、腹泻、头痛、败血症、周围性水肿、腹痛以及呼吸功能紊乱、肝功能试验值增高。(2)少见过敏反应、虚弱、背痛、注射部位疼痛、房性心律失常、心房颤动、完全性房室传导阻滞、二联率、心动过缓、束支传导阻滞、期外收缩、QT间期延长、室上性心动过速、厌食、便秘、消化不良、腹胀、胃肠炎、齿龈炎、舌炎、肾上腺皮质功能不全、胃炎、甲状腺功能降低、粒细胞缺乏症、贫血、出血

时间延长、发绀、血栓性血小板减少性紫癜、蛋白尿、尿素氮增高、肌酐磷酸激酶增高、高血钾、高镁血症、高钠血症、高尿酸血症、关节痛、肌痛、肌无力、激动、张力过高、感觉减退、失眠、眩晕、咳嗽增加、鼻出血、咽炎、声音改变、血管性水肿、接触性皮炎、光敏性皮肤反应、皮肤出汗、荨麻疹、耳聋、耳痛、眼痛、眼干、味觉异常、排尿困难、少尿、尿潴留。

【用法与用量】(1) 成人：①静脉滴注和口服的互换用法。无论是静脉滴注或口服给药，首次给药时第一日均应给予首次负荷剂量。以使其血药浓度在给药第1日即接近于稳态浓度。由于口服片剂的生物利用度很高(96%)，所以在有临床指征时静脉滴注和口服两种给药途径可以互换。口服：负荷剂量(适用于第1个24小时)：患者体重≥40 kg，每12小时给药1次，一次400 mg；患者体重＜40 kg，每12小时给药1次，一次200 mg。维持剂量(开始用药24小时以后)：患者体重≥40 kg，一日给药2次，一次200 mg；患者体重＜40 kg，一日给药2次，一次100 mg。静脉滴注：负荷剂量(适用于第1个24 小时)：每12小时给药1次，一次6 mg/kg；维持剂量(开始用药24小时以后)：一日给药2次，一次4 mg/kg。静脉滴注前先溶解成10 mg/ml，再稀释至不高于5 mg/ml的浓度。静脉滴注速度最快不超过每小时3 mg/kg。禁止和其他静脉药物(包括血制品、电解质)在同一输液通路中同时滴注。使用全肠外营养时不需要停用，但需要分不同的静脉通路滴注。②序贯疗法：静脉滴注和口服给药尚可以进行序贯治疗，此时口服给药无需给予负荷剂量，因为此前静脉滴注给药已经使伏立康唑血药浓度达稳态。③疗程：视患者用药后的临床和微生物学反应而定。静脉用药的疗程不宜超过6个月。④剂量调整：在治疗过程中，医生应当严密监测其潜在的不良反应，并根据患者具体情况及时调整药物方案。静脉给药：如果患者不能耐受一日2次，一次4 mg/kg静脉滴注，可减为一日2次，一次3 mg/kg。与苯妥因或利福布汀合用时，建议伏立康唑的静脉维持剂量增加为一日静脉滴注2次，一次5 mg/kg。口服给药：如果患者治疗反应欠佳，口服给药的维持剂量可以增加到一日2次，一次300 mg；体重＜40 kg的患者剂量调整为一日2次，一次150 mg。如果患者不能耐受上述较高的剂量，口服给药的维持剂量可以一次减50 mg，逐渐减到一日2次，一次200 mg(体重＜40 kg的患者减到一日2次，一次100 mg)。(2) 肾功能损害者用药：中度到严重肾功能减退(肌酐清除率＜50 ml/min)的患者应用注射剂时，可发生赋形剂磺丁倍他环糊精钠(SBECD)蓄积。此种患者宜选用口服给药，除非应用静脉制剂的利大于弊。伏立康唑可经血液透析清除，清除率为每分钟121 ml。4小时的血液透析仅能清除少量药物，无需调整剂量。静脉制剂的赋形剂磺丁倍他环糊精钠(SBECD)在血液透析中的清除率为每分钟55 ml。(3)急性肝损害者(ALT和AST增高)无需调整剂量，但应继续监测肝功能以观察是否有进一步升高。建议轻度到中度肝硬化患者(Child-Pugh A和B)伏立康唑的负荷剂量不变，但维持剂量减半。(4) 儿童(2岁到＜12岁)：口服和静脉给药不用负荷剂量。静脉滴注，一日2次，一次7 mg/kg。口服，一日2次，一次200 mg。如果儿童患者不能耐受一日2次，一次7 mg/kg静脉滴注，可减为一日2次，一次4 mg/kg。这个剂量相当于成年人中一日2次，一次3 mg/kg的暴露量。

【制剂与规格】伏立康唑片：① 50 mg；② 200 mg。

伏立康唑干混悬剂：40 mg/ml。

注射用伏立康唑：200 mg。

卡泊芬净[保(乙)]

Caspofungin

【适应证】(1) 对其他药物治疗无效或不能耐受的侵袭性曲霉菌病。(2) 念珠菌所致的食管炎、菌血症、腹腔内脓肿、腹膜炎及胸膜腔感染。

【注意事项】(1) 与环孢素同时使用，需权衡利弊。(2) 不推荐18岁以下的患者使用。

【禁忌证】对本品中任何成分过敏者、哺乳期及妊娠妇女禁用。

【不良反应】(1) 常见发热、头痛、腹痛、疼痛、恶心、腹泻、呕吐、AST、ALT 升高、贫血、静脉炎／血栓性静脉炎。静脉输注并发症、皮肤皮疹、瘙痒等。(2) 实验室检查异常：低白蛋白、低钾、低镁血症、白细胞减少、嗜酸性粒细胞增多、血小板减少、中性白细胞减少、尿中红细胞增多、部分凝血激酶时间延长、血清总蛋白降低、尿蛋白增多、凝血酶原时间延长、低钠、尿中白细胞增多及低钙。

【用法与用量】静脉滴注：成人，(1) 首日一次 70 mg 负荷剂量，之后给予维持剂量一日 50 mg 的。疗效欠佳且对本品耐受较好的患者，可将维持剂量加至一日 70 mg。输注液须用大约 1 小时经静脉缓慢输注。(2) 中度肝功能不全(Child-Pugh 评分 7 至 9) 患者，将维持剂量减至一日 35 mg。尚无重度肝功能不全 (Child-Pugh 评分大于 9) 患者的临床用药经验。(3) 与具有代谢诱导作用的药物依非韦伦、奈韦拉平、利福平、地塞米松、苯妥英钠或卡马西平同时使用时，应给予一日 70 mg。(4) 注射液的配制：①不得使用任何含有葡萄糖的稀释液，因为卡泊芬净在含有葡萄糖的稀释液中不稳定。不得将卡泊芬净与任何其他药物混合或同时输注。②溶解药瓶中的药物：在无菌条件下加入 10.5 ml 的无菌注射用水、或含有对羟基苯甲酸甲酯和对羟基苯甲酸丙酯的无菌注射用水、或含有 0.9% 苯甲醇的无菌注射用水。溶解后瓶中药液的浓度将分别为 7 mg/ml (每瓶 70 mg 装) 或 5 mg/ml (每瓶 50mg 装)。轻轻混合，直到获得透明的溶液。保存于 25℃或以下温度的此溶液，在 24 小时之内可以使用。③配制供患者输注的溶液：将上述溶解的药物用无菌注射用生理盐水或乳酸化的林格溶液 250 ml 稀释，如医疗上需要一日剂量为 50 mg 或 35 mg，可将输注液的容积减少到 100 ml。溶液浑浊或出现沉淀，不得使用。如输注液储存于 25℃或以下温度的环境中，必须在 24 小时内使用；如储存于 2 ～ 8℃的冰箱中，则必须在 48 小时内使用。

【制剂与规格】注射用醋酸卡泊芬净：① 50 mg；② 70 mg。

米卡芬净 [保(乙)]

Micafungin

【适应证】用于曲霉菌和念珠菌引起的真菌血症、呼吸道真菌病、胃肠道真菌病。

【注意事项】(1) 有药物过敏史的患者和肝功能不全患者慎用。(2) 可能出现肝功能异常或黄疸。应严密监测患者的肝功能。(3) 溶解本品时勿用力摇晃输液袋，因易起泡，且泡沫不易消失。(4) 本品在光线下可慢慢分解，给药时注意应避免阳光直射。如果从配制到输液结束需时超过 6 小时，应将输液袋遮光（不必将输液管遮光)。(5) 孕妇或可能妊娠的妇女以及哺乳期妇女女使用时需权衡利弊。(6) 儿童使用的安全性尚未确立。老年患者应慎重决定使用剂量。

【禁忌证】禁用于对本品任何成分有过敏史者禁忌。

【不良反应】(1) 血液学异常：可能发生中性粒细胞减少症、血小板减少或溶血性贫血。(2) 可能发生休克、过敏样反应：必须密切观察患者，一旦发现应停止治疗。必要时必须采取适当措施。(3) 可能出现肝功能异常或黄疸。(4) 可能发生严重肾功能不全如急性肾衰竭。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：成人一次 50 ～ 150 mg，一日 1 次。严重或者难治性患者，可增加至一日 300 mg。静脉滴注本品时，应将其溶于 0.9% 氯化钠注射液、葡萄糖注射液或者补充液，剂量为 75 mg 或以下时，滴注时间不少于 30 分钟；剂量为 75 mg 以上时滴注时间不少于 1 小时。切勿使用注射用水溶解本品。(2) 注意：由于将本品剂量增加至一日 300 mg 用以治疗严重或难治性感染的安全性尚未完全确立，应密切观察患者的病情。体重为 50 kg 或以下的患者，一日剂量不应超过 6mg/kg。

【制剂与规格】注射用米卡芬净钠：50 mg。

特比萘芬[保(乙)]

Terbinafine

【适应证】(1) 毛癣菌（红色毛癣菌、须癣毛癣菌、断发癣菌、紫色毛癣菌和疣状毛癣菌等）、狗小孢子菌和絮状表皮癣菌等引起的皮肤、头发和甲的感染。(2) 各种癣病（体癣、股癣、手足癣和头癣等）及念珠菌（白色念珠菌等）引起的皮肤酵母菌感染。(3) 皮霉菌引起的甲癣（甲真菌感染）。

【注意事项】(1) 肝或肾功能不全（肌酐清除率每分钟＜50 ml，或血清肌酐＞300 μmol/l）者，剂量应减少50%。(2) 口服对花斑癣无效。(3) 孕妇使用需权衡利弊。(4) 口服治疗的母亲不应哺乳。(5) 使用过程中如出现不良反应症状，应停止用药。(6) 软膏、凝胶及擦剂仅供局部皮肤使用皮肤涂敷后，可不必包扎。不宜用于开放性伤口，不能用于眼内，避免接触鼻、口腔及其他黏膜。(7) 软膏、凝胶及搽剂连续用药1个疗程后，如症状未改善，应向医师咨询。

【禁忌证】对特比萘芬或萘替芬及本品制剂中其他成分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 最常见：胃肠道症状（胀满感，食欲减退，恶心，轻度腹痛及腹泻）或轻型的皮肤反应（皮疹，荨麻疹等）。(2)个别严重的有皮肤反应病例（如Stevens-Johnson 综合征，中毒性表皮坏死松解症）。(3) 罕见味觉改变，于停药后几周内可恢复。(4) 极个别病例发生肝胆功能不全。(5) 极个别患者发生中性白细胞减少。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次0.125～0.25 g，一日1次。各种感染的疗程：①手足癣[指(趾)间型和跖型]，2～6周；②体癣、股癣，2～4周；③皮肤念珠菌病，2～4周。头发和头皮感染（头癣），4周。甲癣：绝大多数患者疗程为6周～3个月，其中年轻患者因甲生长正常而能缩短疗程，故除拇指（趾）甲外，小于3个月的治疗可能已足够。在其他患者中，疗程通常只需3个月。某些患者，特别是那些大拇指（趾）甲感染的患者，可能需6个月或更长的时间。在第1周治疗中见到的甲生长缓慢的患者，其疗程可能需超过3个月。(2) 局部外用：适量涂敷患处及其周围，一日2次。体、股癣连续用药2～4周；手、足癣，花斑癣连续用药4～6周。

【制剂与规格】盐酸特比萘芬片：①0.125 g；②0.25 g。

盐酸特比萘芬散：10 g：0.1 g。

盐酸特比萘芬溶液剂：30 ml：0.3 g。

盐酸特比萘芬喷雾剂：15 ml：0.15 g。

盐酸特比萘芬擦剂：15ml：0.15 g。

盐酸特比萘芬软膏：①10 g：0.1 g；②15 g：0.15 g。

盐酸特比萘芬凝胶：①10 g：0.1 g；②5 g：50 mg。

氟胞嘧啶[保(乙)]

Flucytosine

【适应证】用于念珠菌属心内膜炎、隐球菌属脑膜炎、念珠菌属或隐球菌属真菌败血症、肺部感染和尿路感染。

【注意事项】(1) 单用氟胞嘧啶在短期内可产生真菌对本品的耐药菌株。治疗播散性真菌病时通常与两性霉素B联合应用。(2) 下列情况应慎用：①骨髓抑制、血液系统疾病、或同时接受骨髓抑制药物。②肝功能损害。③肾功能损害，尤其是与两性霉素B或其他肾毒性药物同用时。(3) 肾功能减退者需减量用药，并根据血药浓度测定结果调整剂量。老年人需减量。(4) 用药期间应进行下列检查：①造血功能，需定期检查周围血象。②肝功能，定期检查AST及ALT、碱性磷酸酶和血胆红素等。③肾功能，定期检查尿常规、血肌酐和尿素氮。④肾功能减退者需监测血药浓度，峰浓度以40～60 mg/L为宜，不宜超过80 mg/L。(5) 定期进行血液透析治疗的患者，一次透析后应补给37.5 mg/kg的一次剂量。腹膜透析者一日补给0.5～1.0 g。(6) 对孕妇使用需权衡利弊，哺乳期妇女于使用时停止哺乳。(7) 缺乏儿童使用资料，不宜使用。

【禁忌证】严重肾功能不全及对本品过敏患者禁用。

【不良反应】(1) 可致恶心、呕吐、厌食、腹痛、腹泻等胃肠道反应。(2) 皮疹、嗜

酸性粒细胞增多等变态反应。(3) 可发生肝毒性反应，一般表现为 ALT 及 AST 一过性升高，偶见血清胆红素升高。(4) 可致白细胞或血小板减少，偶可发生全血细胞减少，骨髓抑制和再生障碍性贫血。合用两性霉素 B 者较单用本品为多见，此不良反应的发生与血药浓度过高有关。(5) 偶可发生暂时性神经精神异常，表现为精神错乱、幻觉、定向力障碍和头痛、头晕等。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 1.0 ~ 1.5 g，一日 4 次，为避免或减少恶心，呕吐，一次服药时间持续 15 分钟。(2) 静脉滴注：成人一日 0.1 ~ 0.15 g/kg，分 2 ~ 3 次给药，滴注速度每分钟 4 ~ 10 ml。

【制剂与规格】氟胞嘧啶片：①0.25 g；② 0.5 g。

氟胞嘧啶注射液：250 ml ：2.5 g。

制霉菌素（制霉素）[基（基）.保（甲）]

Nystatin

【适应证】(1) 口服用于治疗消化道念珠菌病。(2) 局部用于治疗阴道念珠菌病、皮肤念珠菌感染等。(3) 用于口腔念珠菌病，可将本品敷于义齿黏膜面，再戴上义齿；用于难愈的口腔黏膜病损如天疱疮、糜烂型口腔扁平苔藓等，配合糖皮质激素局部制剂。

【注意事项】(1) 本品对全身真菌感染无治疗作用。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(3) 5 岁以下儿童不推荐使用。(4) 本品混悬剂在室温中不稳定，临用前宜新鲜配制并于短期用完。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】口服较大剂量时可发生腹泻、恶心、呕吐和上腹疼痛等消化道反应，减量或停药后迅速消失。局部应用可引起过敏性接触性皮炎。个别患者阴道应用后可引起阴道白带增多。

【用法与用量】(1) 口服：用于消化道念珠菌病，成人一次 50 万 ~ 100 万 U，一日 3 次；小儿按体重一日 5 万 ~ 10 万 U/kg，分 3 ~ 4 次服用。(2) 外用：用于阴道念珠菌感染或真菌性外阴道炎，应用阴道片或栓剂一次 1 枚，一日 1 ~ 2 次；用于皮肤念珠菌感染，应用软膏剂，一次 1 ~ 2 g 或适量涂敷，一日 1 ~ 2 次。(3) 用于口腔科念珠菌感染，取适量糊剂涂布，2 ~ 3 小时 1 次，涂布后可咽下；口含片一次 1 ~ 2 片，一日 3 次。

【制剂与规格】制霉菌素片：(1) 10 万 U；(2) 25 万 U；(3) 50 万 U。

制霉菌素阴道泡腾片：10 万 U。

制霉菌素口含片：10 万 U。

制霉菌素阴道栓：10 万 U。

制霉菌素软膏 (1) 1 g：10 万 U；(2) 1 g：20 万 U。

制霉菌素糊：1 g：10 万 U。

9.8 寄生虫感染及其药物治疗

常见的人体寄生虫病可分为原虫病（主要包括疟疾、黑热病、弓形虫病、阿米巴病和滴虫病等）、吸虫病（主要包括血吸虫病等）、线虫病（主要包括钩虫病、蛔虫病、蛲虫病、鞭虫病、丝虫病等）和绦虫病（带绦虫病、包虫病等）。

9.8.1 疟疾及其药物治疗和预防

疟疾（malaria）是由疟原虫感染的疾病。我国卫生部于 2009-07-06 公布的《抗疟药使用原则和用药方案（修订稿）》所规定的抗疟药使用原则和用药方案如下（注：方案中剂量均为成人剂量，儿童剂量按体重或年龄递减）。

9.8.1.1 间日疟的药物治疗

首选氯喹加伯氨喹。治疗无效时，可选用以青蒿素类药物为基础的复方或联合用药的口服剂型进行治疗。

氯喹加伯氨喹：氯喹口服总剂量 1 200 mg。第 1 日 600 mg 顿服，或分 2 次服，每次 300 mg；第 2、3 日各服 1 次，一次 300 mg。伯氨喹口服总剂量 180 mg。从服用氯喹的第 1 日起，同时服用伯氨喹，一日 1 次，每次 22.5 mg，连服 8 日。

9.8.1.2 卵形疟和三日疟的药物治疗

同间日疟。

9.8.1.3 恶性疟的药物治疗

以青蒿素类药物为基础的复方或联合

用药，包括青蒿琥酯加阿莫地喹、双氢青蒿素哌喹、复方萘酚喹、复方青蒿素等。

（1）青蒿琥酯片加阿莫地喹片：口服总剂量青蒿琥酯和阿莫地喹各12片（青蒿琥酯每片50 mg，阿莫地喹每片150 mg），每日顿服青蒿琥酯片和阿莫地喹片各4片，连服3日。

（2）双氢青蒿素哌喹片：口服总剂量8片（每片含双氢青蒿素40 mg，磷酸哌喹320 mg），首剂2片，首剂后6～8小时、24小时、32小时各服2片。

（3）复方磷酸萘酚喹片：口服总剂量8片（每片含萘酚喹50 mg，青蒿素125 mg），一次服用。

（4）复方青蒿素片：口服总剂量4片（每片含青蒿素62.5 mg，哌喹375 mg），首剂2片，24小时后再服2片。

9.8.1.4 重症疟疾的药物治疗

可应用注射剂，如青蒿素类药物的注射剂（包括蒿甲醚和青蒿琥酯）或磷酸咯萘啶注射剂。选用以下方案：

（1）蒿甲醚注射剂：肌内注射每日1次，每次80 mg，连续7日，首剂加倍。若病情严重时，首剂给药后4～6小时可再肌注80 mg。

（2）青蒿琥酯注射剂：静脉注射每日1次，每次60 mg，连续7日，首剂加倍。若病情严重时，首剂给药后4～6小时，可再静脉注射60 mg。

采用上述两种注射疗法治疗，患者病情缓解并且能够进食后，改用ACT口服剂型，再进行一个疗程治疗。

（3）咯萘啶注射剂：肌内注射或静脉滴注，总剂量均为480 mg。每日1次，每次160 mg，连续3日。需加大剂量时，总剂量不得超过640 mg。

9.8.1.5 妊娠期疟疾的药物治疗

孕妇患间日疟可采用氯喹治疗。孕期3个月以内的恶性疟患者可选用磷酸哌喹，孕期3个月以上的恶性疟患者采用ACT治疗。孕妇患重症疟疾应选用蒿甲醚或青蒿琥酯注射剂治疗。

9.8.1.6 间日疟的休止期根治

伯氨喹，口服总剂量180 mg，每日1次，每次22.5 mg，连服8日。

9.8.1.7 预防性用药

选用以下方案：

（1）哌喹：1个月1次，每次服600 mg，睡前服。

（2）氯喹：7～10日服1次，每次服300 mg。

9.8.1.8 抗疟原虫药

氯喹[基（基），保（甲）]

Chloroquine

【适应证】（1）用于治疗对氯喹敏感的恶性疟、间日疟及三日疟。（2）可用于疟疾症状的抑制性预防。（3）也可用于治疗肠外阿米巴病、结缔组织病、光敏感性疾病（如日晒红斑）等。

【注意事项】（1）肝肾功能不全、心脏病、重型多型红斑、血卟啉病、银屑病及精神病患者慎用。（2）氯喹可引起胎儿脑积水、四肢畸形及耳聋。（3）耐氯喹者效果不佳。（4）孕妇禁用，哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】孕妇禁用。

【不良反应】（1）氯喹用于治疗疟疾时，不良反应较少，口服一般可能出现的反应有：头晕、头痛、眼花、食欲减退、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、皮肤瘙痒、皮疹、甚至剥脱性皮炎、耳鸣、烦躁等。反应大多较轻，停药后可自行消失。（2）在治疗肺吸虫病、华支睾吸虫病及结缔组织疾病时，用药量大，疗程长，可能会有较重的反应，常见者为对眼的毒性，因氯喹可由泪腺分泌，并由角膜吸收，在角膜上出现弥漫性白色颗粒，停药后可消失。（3）氯喹相当部分在组织内蓄积，久服可致视网膜轻度水肿和色素聚集，出现暗点，影响视力，常为不可逆。（4）氯喹还可损害听力，妊娠妇女大量服用可造成小儿先天性耳聋，智力迟钝、脑积水、四肢缺陷等。（5）氯喹偶可引起窦房结的抑制，导致心律失常、休克，严重时可发生阿-斯综合征，而导致死亡。（6）氯喹尚可导致药物性精神病、白细胞减少、紫癜、皮疹、皮炎，光敏性皮炎乃至剥脱性皮炎、银屑

病、毛发变白、脱毛、神经肌肉痛、轻度短暂头痛等。(7) 溶血、再障、可逆性粒细胞缺乏症、血小板减少等较为罕见。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量：间日疟，口服首剂 1 g，第 2、3 日各 0.75 g。抑制性预防疟疾，口服一周 1 次，一次 0.5 g。肠外阿米巴病，口服一日 1 g，连服 2 日后改为一日 0.5 g，总疗程为3周。类风湿关节炎，一日 0.25 ~ 0.5 g，待症状控制后，改为 0.125 g，一日 2 ~ 3 次，需服用 6 周至 6 个月才能达到最大的疗效，可作为水杨酸制剂及递减肾上腺皮质激素时的辅助药物。②儿童常用量：间日疟，口服首次剂量按体重 10 mg/kg（以氯喹计算，以下同），最大量不超过 600 mg，6 小时后按体重 5 mg/kg 再服 1 次，第 2、3 日一日按体重 5 mg/kg。肠外阿米巴病，一日按体重口服 10 mg/kg（最大量不超过 600 mg），分 2 ~ 3 次服，连服 2 周，休息 1 周后，可重复 1 个疗程。(2) 静脉滴注：氯喹注射液禁止做静脉注射，不宜做肌内注射。①成人：脑型疟患者第 1 日静脉滴注 18 ~ 24 mg/kg（体重超过 60 kg 者按 60 kg 计算），第 2 日 12 mg/kg，第 3 日 10 mg/kg。浓度为每 0.5 g 磷酸氯喹加入 10% 葡萄糖溶液或 5% 葡萄糖 0.9% 氯化钠注射液 500 ml 中，静脉滴注速度为每分钟 12 ~ 20 滴。②儿童：剂量同成人，但宜慎用静脉内给药。

【制剂与规格】磷酸氯喹片：① 0.075 g；② 0.25 g。

磷酸氯喹注射液：2 ml：80 mg（相当于磷酸氯喹 0.129 g）。

羟氯喹[保(乙)]

Hydroxychloroquine

【适应证】用于预防疟疾发作和治疗疟疾急性发作及治疗盘状红斑狼疮及系统性红斑狼疮。

【注意事项】(1) 银屑病患者及卟啉症患者使用后均可使原病症加重。故不应使用于这些患者，除非根据医师判断，患者的得益将超过其可能的风险。(2) 接受长期或高剂量治疗的某些患者，已观察到有不可逆视网膜损伤，据报道视网膜病变具有剂量相关性。(3) 服用羟氯喹应进行初次（基线）以及定期（每 3 个月 1 次）的眼科检查（包括视敏度、输出裂隙灯、眼底及视野检查）。(4) 如果视敏度、视野或视网膜黄斑区出现任何异常迹象（如色素变化，失去中心凹反射）或出现任何视觉症状（如闪光和划线），且不能用调节困难或角膜混浊完全解释时，应当立即停药，并密切观察其可能的进展。即使在停止治疗之后，视网膜改变（及视觉障碍）仍可能进展。(5) 长期治疗的所有患者应定期随访和检查，包括检查膝和踝反射，以及发现肌肉软弱的任何迹象。如发现肌软弱，应当停药。(6) 肝病或醇中毒患者，或者与已知有肝毒性的药物合用时，应慎用。(7) 对长期接受本品治疗的患者应定期做血细胞计数。如出现不能归因于所治疾病的任何严重血液障碍，应当考虑停药。缺乏 G-6-PD（葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶）的患者应慎用本品。(8) 服用羟氯喹可出现皮肤反应，因此对接受有产生皮炎的明显倾向的药物的任何患者给予羟氯喹时，应适当注意。(9) 早期诊断“硫酸羟氯喹视网膜病变”的推荐方法，包括：①用检眼镜检查黄斑是否出现细微的色素紊乱或失去中心凹反射；②用小的红色视标检查中心，视野是否有中心周围或中心房的盲点，或者确定对于红色的视网膜阈。任何不能解释的视觉症状如闪光或划线，也应当怀疑是视网膜病变的可能表现。(10) 因过量或过敏而出现严重中毒症状时，建议给予氯化铵口服（成人一日 8 g，分次服用），一周 3 或 4 日，在停止治疗后使用数月，因为尿液酸化可使 4- 氨基喹啉化合物的肾排泄增加 20% ~ 90%，然而对肾功能损伤的患者及或代谢性酸中毒患者应当谨慎。

【禁忌证】对任何 4- 氨基喹啉化合物治疗可引起的视网膜或视野改变者、已知对 4- 氨基喹啉化合物过敏的患者、孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】4- 氨基喹啉类化合物在长期治疗时可能发生下列反应，但不同化合物的不良反应其及类型和发生率可能有所不同。(1) 中枢神经系统：兴奋、神经过敏、情绪改变、梦魇、精神病、头痛、头晕、眩晕、耳鸣、眼球震颤、神经性

聋、惊厥、共济失调。(2) 神经肌肉系统：眼外肌麻痹、骨骼肌软弱、深肌腱反射消失或减退。(3) 眼反应：①睫状体：调节障碍，伴视觉模糊的症状。该反应具剂量相关性，停药后可逆转。②角膜：一过性水肿、点状至线状混浊、角膜敏感度减小。常见可逆性伴或不伴症状（视觉模糊，在光线周围出现光晕、畏光）的角膜改变。角膜沉着可能早在开始治疗后 3 周即已出现。羟氯喹角膜改变及视觉副作用的发生率似比氯喹低得多。③视网膜：黄斑水肿、萎缩，异常色素沉着［轻度色素小点出现“牛眼（bull' s-eye）”外观，中心凹反射消失，在暴露于明亮光线（光应激试验）之后黄斑恢复时间增加，在黄斑、黄斑旁及周围视网膜区对红光的视网膜阈提高。④其他眼底改变：包括视盘苍白和萎缩，视网膜小动脉变细，视网膜周围细颗粒状色素紊乱以及晚期出现凸出型脉络膜。⑤视野缺损：中心周围或中心旁盲点、中心盲点伴视敏度下降、罕见视野狭窄。归因于视网膜病变的最常见的视觉症状是：阅读及视物困难（遗漏词、字母或部分物体），畏光，远距视觉模糊，中心或周围视野有区域消失或变黑，闪光及划线。视网膜病变似具有剂量相关性，在一日 1 次治疗数月（罕见）至数年时出现；少数病例在抗疟药治疗停止后数年报道。用 4- 氨基喹啉化合物治疗疟疾一周给药 1 次，长期应用未见视网膜病变。视网膜改变患者可能有视觉症状或者没有症状（伴或不伴视野改变），罕见不伴视网膜明显改变的视觉盲点或视野缺损。视网膜病变即使停药后仍会进展。有许多患者早期的视网膜病变（黄斑色素沉着，有时伴中心、视野缺损）在治疗终止后完全消失或缓解。对红色视标出现中心、旁盲点（有时称前黄斑病变）是早期视网膜功能障碍的征兆，停药后通常是可逆的。少数视网膜改变的病例，包括在定期眼科检查中发现的视网膜色素沉着改变，某些病例也存在视野缺损，发生在停用羟氯喹后。(4) 皮肤：头发变白、脱发、瘙痒、皮肤及黏膜色素沉着、皮疹（荨麻疹、麻疹样、苔藓样、斑丘疹、紫癜、离心形环形红斑和剥脱性皮炎）。(5) 血液系统：如再生障碍性贫血、粒细胞缺乏、白细胞减少，血小板减少，葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶（G-6-PD）缺乏的个体发生溶血。(6) 胃肠道：食欲减退、恶心、呕吐、腹泻及腹部痛性痉挛。(7) 其他：体重减轻，倦怠，卟啉症恶化或加速以及非光敏性银屑病。(8) 局部：罕见心肌病变，其与羟氯喹的关系尚不明确。

【用法与用量】口服：①用于预防疟疾发作，一周 1 次，于一周相同日服用，成人 400 mg，儿童 6.45 mg/kg（相当于 5 mg/kg），但不得超过成人用量，一般在进入疫区 2 周前开始服用或当时服用，成人当日用 800 mg，儿童 5 mg/kg，分为 2 次给药，相隔 6 小时服用，预防用量须一直续至离开疫区后 8 周。②用于治疗疟疾急性发作，成人和儿童首次 10 mg/kg，第 2 次 5 mg/kg（间隔 6 小时），第 3 次 5 mg/kg（距离上次 18 小时），第 4 次 5 mg/kg（距离上次 24 小时）。③用于治疗盘状红斑狼疮及系统性红斑狼疮，成人一日 0.4 g，分 1 ～ 2 次服用，根据患者的反应，该剂量可持续数周或数月。长期维持治疗，可用较小的剂量，一日 0.2 ～ 0.4 g 即可。

【制剂与规格】硫酸羟氯喹片：① 0.1 g；② 0.2 g。

哌喹［保（乙）］

Piperaquine

【适应证】(1) 疟疾的治疗，也可作症状抑制性预防用。尤其是用于耐氯喹虫株所致的恶性疟的治疗与预防。(2) 治疗硅沉着病。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用。(2) 哌喹多积聚于肝脏，若给药量多，间隔时间短则易引起肝脏不可逆病变。(3) 孕妇慎用。

【禁忌证】严重急性肝、肾及心脏疾病者。

【不良反应】可引起头晕，嗜睡，乏力，胃部不适，面部和唇周麻木，对心血管系统的毒性明显小于氯喹。

【用法与用量】口服：剂量按哌喹计。(1) 抑制性预防疟疾。成人每月服 0.6 g，1 个月 1 次，临睡前服，可连服 4 ～ 6 个月，但不宜超过 6 个月。(2) 治疗疟疾。本品

对耐氯喹虫株所致的恶性疟有根治作用，但作用缓慢，宜在奎宁、青蒿素、咯萘啶控制症状后继用本品。成人首次0.6g，第2、3日分别服0.6g及0.3g，总量1.2～2.5g。(3)硅沉着病的防治。预防，成人一次服0.5g，10～15日1次，1个月量1～1.5g；治疗，成人一次0.3～0.75g，一周1次，1个月量2g，半年为1个疗程。间歇1个月后，进行第2个疗程，总疗程3～5年。

【制剂与规格】磷酸哌喹片：① 0.2g；② 0.25g；③ 0.5g。

甲氟喹

Mefloquine

【适应证】(1) 恶性疟及预防对氯喹耐药的恶性疟。(2) 单独使用时只应用于抗氯喹和多药耐药性恶性疟原虫引起的疟疾的预防和治疗，特别适用于在疟疾感染流行区只作短暂停留的无免疫力的旅游者作预防用药。而流行区本地居民不应将其作预防用，以免导致抗甲氟喹疟原虫的出现。

【注意事项】(1) 大剂量甲氟喹能使啮齿类动物发生畸形或发育异常，故不应预防性应用于妊娠妇女。哺乳期间避免使用。(2) 服药期间避免进行需要较高运动共济性能的工作，如驾车。

【禁忌证】对奎宁、奎尼丁或氯喹有不良反应者、有精神病史和惊厥史者、严重肝肾功能不全者、心脏传导障碍者、孕妇及婴幼儿。

【不良反应】常见恶心、呕吐、腹泻、眩晕、平衡失调，也可出现神经精神紊乱。少见皮疹、瘙痒、荨麻疹、头痛、乏力、肌痛、视觉障碍、肝功能失调。罕见血小板、白细胞减少，多形性红斑狼疮及斯-约综合征。

【用法与用量】口服：用于耐氯喹恶性疟的预防：一次250mg，一周1次，进入疫区前1周开始给药至离开后4周。用于恶性疟的治疗：单次250mg（避免空腹服用）。为避免复发，应继续用伯氨喹治疗。

【制剂与规格】甲氟喹片：① 0.25g；② 0.5g。

奎宁[保(甲/乙)]

Quinine

【适应证】(1) 盐酸奎宁用于治疗脑型疟疾和其他严重的恶性疟。(2) 硫酸奎宁用于治疗耐氯喹和耐多种药物虫株所致的恶性疟。也可用于治疗间日疟。(3) 复方奎宁注射液主要用于疟疾的解热。

【注意事项】(1) 对于哮喘、心房纤颤及其他严重心脏疾患、葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏患者和妇女月经期均应慎用。(2) 对诊断的干扰：奎宁可干扰17-羟类固醇的测定。(3) 盐酸奎宁注射液静脉注射易致休克，所以严禁静脉注射。(4) 复方奎宁注射液应深部肌内注射，严禁静脉注射。(5) 孕妇禁用，奎宁有催产作用，并可通过胎盘引起胎儿听力损害及中枢神经系统、四肢的先天损伤。哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】孕妇禁用。

【不良反应】(1) 一日用量超过1g或连用较久，常致金鸡纳反应，此与水杨酸反应大致相似，有耳鸣、头痛、恶心、呕吐，视力、听力减退等症状，严重者产生暂时性耳聋，停药后常可恢复。(2) 24小时内剂量大于4g时，可直接损害神经组织并收缩视网膜血管，出现视野缩小、复视、弱视等。(3) 大剂量中毒时，除上述反应加重外，还可抑制心肌、扩张外周血管而致血压骤降、呼吸变慢变浅、发热、烦躁、谵妄等，多死于呼吸麻痹。(4) 奎宁致死量约8g。(5) 少数患者对奎宁高度敏感，小量即可引起严重金鸡纳反应。(6) 少数恶性疟患者使用小量奎宁可发生急性溶血(黑尿热)致死。(7)奎宁还可以引起皮疹、瘙痒、哮喘等。(8) 静脉滴注应密切观察血压变化。

【用法与用量】(1) 口服：①成人用于治疗耐氯喹虫株引起的恶性疟时，一日1.8g，分次服用，疗程14日。②小儿用于治疗耐氯喹虫株所致的恶性疟时，小于1岁者一日0.1～0.2g，分2～3次服，1～3岁为0.2～0.3g，4～6岁为0.3～0.5g，7～11岁为0.5～1g，疗程10日。(2) 静脉滴注：二盐酸奎宁注射液严禁静脉推注。①成人用量，按体重

5～10 mg/kg（最高量 500 mg），加入 0.9% 氯化钠注射液 500 ml 中静脉滴注，4 小时滴完，12 小时后重复 1 次，病情好转后改口服。②小儿用量，剂量同成人，按体重 5～10 mg/kg（最高量 500 mg）。(3) 肌内注射：复方奎宁注射液严禁静脉注射。成人深部肌内注射，一次 2 ml。

【制剂与规格】硫酸奎宁片：0.3 g。

二盐酸奎宁注射液：① 1ml：0.25 g；② 1 ml：0.5 g；③ 10 ml：0.25 g。

复方奎宁注射液：2 ml：盐酸奎宁 0.136 g、咖啡因 36 mg。

咯萘啶[保（乙）]

Malaridine

【适应证】用于治疗脑型、凶险型及耐氯喹虫株所致的恶性疟，也用于治疗间日疟。

【注意事项】(1) 严重心、肝、肾脏病患者慎用。(2) 肌内注射后局部有硬块，一次注射应改变部位。(3) 用药后尿液可呈红色。(4) 注射液严禁静脉注射。(5) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。(6) 儿童严格按儿童用法用量使用。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】(1) 少数患者出现胃部不适、稀便，偶有恶心、呕吐、头晕、头痛等，反应均轻微，停药后即消失。(2) 少数病例有窦性心动过缓，个别可出现心律失常。(3) 肌内注射部位稍有疼痛感，个别出现红肿、硬结，均可逐渐消失。

【用法与用量】(1) 口服：①成人第 1 日服 2 次，一次 3 片，间隔 4～6 小时；第 2、3 日一日 1 次，一次 3 片。②儿童一日总剂量按体重 24 mg/kg，分 3 次服。(2) 静脉滴注或肌内注射：①成人，静脉滴注一次按体重 3～6 mg/kg，加入 5% 葡萄糖注射液 200～500 ml 中，于 2～3 小时滴完。间隔 6～8 小时重复 1 次，12 小时内总剂量为按体重 12 mg/kg；肌内注射，一次按体重 2～3 mg/kg，共给 2 次，间隔 4～6 小时。②儿童：注射剂量参照成人（按千克体重计算）。

【制剂与规格】磷酸咯萘啶片（以咯萘啶计）：0.1 g。

磷酸咯萘啶注射液（以咯萘啶计）：2 ml：80 mg。

青蒿素[基（基），保（乙）]

Artemisinin

【适应证】用于间日疟、恶性疟的症状控制，以及耐氯喹虫株的治疗，也可用于治疗凶险型恶性疟，如脑型、黄疸型等。

【注意事项】(1) 注射部位较浅时，易引起局部疼痛和硬块。(2) 妊娠妇女慎用。(3) 如肛塞后 2 小时内排便，应补用一次。(4) 青蒿素治疗系统性红斑狼疮及盘状红斑狼疮均可获不同程度的缓解。治疗初期病情可能有所加重，全身出现蚁走感，半个月逐渐减轻，月余后一般情况改善。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】(1) 个别患者可出现一过性 ALT 及 AST 升高及轻度皮疹。(2) 少数病例有恶心、呕吐、腹泻，不加治疗可很快恢复正常。

【用法与用量】(1) 口服：①成人先服 1 g，6～8 小时后再服 0.5 g，第 2、3 日各服 0.5 g，疗程 3 日，总量为 2.5 g。②儿童按体重 15 mg/kg，按上述方法 3 日内服完。(2) 深部肌内注射：①成人第 1 次 200 mg，6～8 小时后再给 100 mg，第 2、3 日各肌内注射 100 mg，总剂量 500 mg（个别重症第 4 日再给 100 mg）。或连用 3 日，一日肌内注射 300 mg，总量 900 mg。②儿童按体重 15 mg/kg，按上述方法 3 日内注完。(3) 直肠给药：成人首次 0.6 g，4 小时后 0.6 g，第 2、3 日各 0.4 g。

【制剂与规格】青蒿素片：① 50 mg；② 100 mg。

青蒿素栓：① 400 mg；② 600 mg。

青蒿素注射液：① 1 ml：50 mg；② 2 ml：100 mg；③ 2 ml：200 mg。

双氢青蒿素[基（基），保（甲）]

Dihydroartemisinin

【适应证】用于各种类型疟疾的症状控制，尤其是对抗氯喹恶性及凶险型疟疾有较好疗效。

【注意事项】妊娠妇女慎用。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】推荐剂量未见不良反应，

少数病例有轻度网织红细胞一过性减少。

【用法与用量】口服：①成人一日3片，一日1次，首剂加倍。②儿童量按年龄递减，连续5～7日。

【制剂与规格】双氢青蒿素片：20 mg。

蒿甲醚[基(基)，保(甲)]

Artemether

【适应证】用于各型疟疾，但主要用于抗氯喹恶性疟治疗和凶险型恶性疟的急救。

【注意事项】(1) 蒿甲醚遇冷如有凝固现象，可微温溶解后使用。(2) 妊娠妇女慎用。

【禁忌证】本品过敏者禁用。

【不良反应】不良反应轻微，个别患者有ALT及AST轻度升高，网织红细胞可能有一过性减少。

【用法与用量】(1) 口服：①成人第1日首剂及首剂后8小时各服2粒，自第2日起，一日1次，一次2粒，连续7日。②儿童5～10周岁者为成人剂量的1/3～1/2，10～15周岁者为成人剂量的2/3～3/4。给药时间及疗程同成人，或遵医嘱。(2) 肌内注射：①成人首剂160 mg，第2日起一日1次、一次80 mg，连用5日。②儿童首剂按体重3.2 mg/kg；第2～5日，一次按体重1.6 mg/kg，一日1次。

【制剂与规格】蒿甲醚片：① 25 mg；② 40 mg。

蒿甲醚胶丸：40 mg。

蒿甲醚胶囊：① 40 mg；② 100 mg。

复方蒿甲醚片：每片含本芴醇120 mg、蒿甲醚20 mg。

蒿甲醚注射液：①0.5 ml：40 mg；② 1 ml ：80 mg；③ 1 ml ：100 mg；④ 2 ml ：200 mg。

青蒿琥酯[基(基)，保(甲)]

Artesunate

【适应证】用于脑型疟及各种危重疟疾的抢救。

【注意事项】孕妇慎用。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】使用过量（> 2.75 mg/kg)可能出现外周网织红细胞一过性降低。

【用法与用量】(1) 静脉注射：临用前加入所附的5%碳酸氢钠注射液0.6 ml，振摇2分钟，待完全溶解后，加5%葡萄糖注射液或葡萄糖0.9%氯化钠注射液5.4 ml稀释，使每1 ml溶液含青蒿琥酯10 mg，缓慢静脉注射。①成人首次60 mg（或按体重1.2 mg/kg)，24、48小时各重复注射1次。②7岁以下按体重1.5 mg/kg，首次剂量后4、24、48小时各重复注射1次。③危重者首次剂量可加至120 mg，3日为1个疗程，总剂量为240～300 mg。(2) 口服：首剂100 mg，第2日起一次50 mg，一日2次，连服5日。

【制剂与规格】青蒿琥酯片：① 50 mg，② 100 mg。

注射用青蒿琥酯：60 mg。

本芴醇

Benflumetol

【适应证】用于治疗恶性疟疾，尤其适用于抗氯喹虫株所致的恶性疟疾的治疗。

【注意事项】(1) 心脏病和肾脏病患者慎用。(2) 恶性疟患者，在症状控制后，即可用磷酸伯氨喹杀灭配子体。(3) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】少数患者可出现心电图QT间期一过性轻度延长。

【用法与用量】口服：①成人首日0.8 g顿服，第2、3、4日各0.4 g。②儿童一日按体重8 mg/kg顿服，连服4日，首剂加倍，但首剂不宜超过0.6 g。

【制剂与规格】本芴醇胶丸：0.1 g。

伯氨喹[基(基)，保(甲)]

Primaquine

【适应证】用于根治间日疟和控制疟疾传播。

【注意事项】(1) 仔细询问有无蚕豆病及其他溶血性贫血的病史及家族史、有无葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏及烟酰胺腺嘌呤二核苷酸还原酶（NADH）缺乏等病史。(2) 肝、肾、血液系统疾病，急性细

菌和病毒感染及糖尿病患者慎用。(3)应定期检查红细胞计数及血红蛋白量。(4) 哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】(1) 孕妇禁用。(2) 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者禁用。(3) 系统性红斑狼疮及类风湿关节炎患者禁用。

【不良反应】(1) 伯氨喹的毒性反应较其他抗疟药为高。当一日用量超过 30 mg (基质) 时,易发生疲倦、头晕、恶心、呕吐、腹痛等不良反应;少数人可出现药物热,粒细胞缺乏等,停药后即可恢复。(2) 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者服用本品可发生急性溶血型贫血,这种溶血反映仅限于衰老的红细胞,并能自行停止发展,一般不严重。一旦发生应停药,做适当的对症治疗。当葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏时,会引起高铁血红蛋白过多症,出现发绀、胸闷等症状,应用亚甲蓝 1 ~ 2 mg/kg 做静脉注射,能迅速改善症状。

【用法与用量】口服:①成人按伯氨喹计。根治间日疟一日 3 片,连服 7 日。用于杀灭恶性疟配子体时,一日 2 片,连服 3 日。②儿童按伯氨喹计,根治间日疟一日按体重 0.39 mg/kg,连服 14 日。用于杀灭恶性疟配子体时,剂量相同,连服 3 日。

【制剂与规格】磷酸伯氨喹片:13.2 mg。

乙胺嘧啶 [保(甲/乙)]

Pyrimethamine

【适应证】用于疟疾的预防,也用于治疗弓形虫病。

【注意事项】(1) 下列情况应慎用:①意识障碍,大剂量治疗弓形虫病时可引起中枢神经系统毒性反应并可干扰叶酸代谢;② G-6-PD 缺乏者,服用本品可能引起溶血性贫血;③巨细胞性贫血患者,服用本品可影响叶酸代谢。(2) 大剂量治疗时一周应检测白细胞及血小板 2 次。(3) 儿童用药过量易引起急性中毒。

【禁忌证】(1) 妊娠妇女禁用,动物实验证明本品可引起胎仔畸形。(2) 哺乳期妇女亦禁用,因乙胺嘧啶可由乳汁排出,干扰婴儿的叶酸代谢,若婴儿有葡萄糖-6-磷酸脱氢酶 (G-6-PD) 缺乏,则可引起溶血性贫血。

【不良反应】口服:一般抗疟治疗量时,毒性很低,较为安全。大剂量应用时,如一日用 25 mg,连服 1 个月以上,就会出现叶酸缺乏现象。主要影响生长繁殖特别迅速的组织,如骨髓、消化道黏膜,引起造血功能及消化道症状,如味觉的改变或丧失,舌头疼痛、红肿、烧灼感及针刺感,口腔溃疡、白斑等,食管炎所致的吞咽困难、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等。较严重的是巨细胞性贫血、白细胞减少症等,如及早停药,能自行恢复。甲酰四氢叶酸可改善骨髓功能。此外,由过敏所致的皮肤红斑则较少见。

【用法与用量】口服:①成人:预防用药,应于进入疫区前 1 ~ 2 周开始服用,一般宜服至离开疫区后 6 ~ 8 周,一周服 4 片;耐氯喹虫株所致的恶性疟,一日 2 片,分 2 次服,疗程 3 日;治疗弓形虫病,一日 50 ~ 100 mg 顿服,共 1 ~ 3 日(视耐受力而定),然后一日服 25 mg,疗程 4 ~ 6 周。②儿童:预防用药,一次按体重 0.9 mg/kg,一周服 1 次,最高剂量以成人量为限;耐氯喹虫株所致的恶性疟,一次按体重 0.3 mg/kg,一日 3 次,疗程 3 日;弓形虫病,一日按体重 1 mg/kg,分 2 次服,服用 1 ~ 3 日后改为一日 0.5 mg/kg,分 2 次服,疗程 4 ~ 6 周。

【制剂与规格】乙胺嘧啶片:6.25 mg。乙胺嘧啶膜:6.25 mg。

磺胺多辛 [保(乙)]

Sulfadoxine

【适应证】与乙胺嘧啶联合可用于防治耐氯喹的恶性疟原虫所致的疟疾,也可用于疟疾的预防。

【注意事项】(1) 下列情况应慎用:缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶、肝功能不全、肾功能不全、血卟啉症、失水、艾滋病、休克和老年患者。(2) 交叉过敏反应。对一种磺胺药呈现过敏的患者对其他磺胺药可能过敏。(3) 对呋塞米、砜类、噻嗪类利尿药、磺脲类、碳酸酐酶抑制药呈现过敏的患者,对磺胺药亦可过敏。(4) 每次服用本品时应饮用足量水分(约 240 ml),餐前 1 小时或餐后 2 小时服用。(5) 治疗

中须注意检查：①全血象检查，对接受较长疗程的患者尤为重要。②治疗中定期尿液检查（每 2 ~ 3 日查尿常规一次）以发现长疗程或高剂量治疗时可能发生的结晶尿。③肝、肾功能检查。(6) 严重感染者应测定血药浓度，对大多数感染性疾患游离磺胺浓度达 50 ~ 150 μg/ml（严重感染 120 ~ 150 μg/ml）可有效。总磺胺血浓度不应超过 200 μg/ml，如超过此浓度，不良反应发生率增高。(7) 新生儿患者和 2 个月以内婴儿除治疗先天性弓形虫病时可作为乙胺嘧啶联合用药外，全身应用属禁忌。(8) 不可任意加大剂量、增加用药次数或延长疗程，以防蓄积中毒。(9) 由于本品能抑制大肠埃希菌的生长，妨碍 B 族维生素在肠内的合成，故使用本品超过 1 周以上者，应同时给予维生素 B 以预防其缺乏。(10) 老年患者应用磺胺药发生严重不良反应的机会增加。老年患者宜避免应用，确有指征时需权衡利弊后决定。

【禁忌证】对磺胺类药物过敏者、妊娠及哺乳期妇女、小于 2 个月婴儿、巨幼细胞性贫血患者、重度肝肾功能损害者禁用。

【不良反应】(1) 常见过敏反应：药疹，渗出性多形红斑、剥脱性皮炎和大疱表皮松解萎缩性皮炎、光敏反应、药物热、关节及肌肉疼痛、发热等血清病样反应。(2) 中性粒细胞减少或缺乏症、血小板减少症及再生障碍性贫血。(3) 溶血性贫血及血红蛋白尿。缺乏葡萄糖 6- 磷酸脱氢酶患者应用磺胺药后易发生，在新生儿和小儿中较成人为多见。(4) 高胆红素血症和新生儿核黄疸。(5) 肝、肾功能损害。(6) 恶心、呕吐、胃纳减退、腹泻、头痛、乏力等。(7) 偶有甲状腺肿大及功能减退。(8) 偶可发生精神错乱、定向力障碍、幻觉、欣快感或抑郁感。

【用法与用量】口服：首次 1~1.5 g，以后 0.5 ~ 1g，每 4 ~ 7 日服一次。

【制剂与规格】磺胺多辛片：0.5 g。

9.8.2 黑热病及其药物治疗

9.8.2.1 黑热病的药物治疗

黑热病（kala-azar）又称内脏利什曼病，是由杜氏利什曼原虫引起、经白蛉传播的慢性地方性传染病。临床特点为长期不规则发热、消瘦贫血、肝脾进行性肿大及全血细胞减少。

◆ 抗病原治疗：首选，葡萄糖酸锑钠，成人总量为 90 ~ 130 mg/kg（按锑计算），儿童总量为 150 ~ 170 mg/kg（按锑计算），平分 6 次用药，肌内注射或静脉缓慢注射，一日 1 次，共 6 日。重症及体质较差者可采用 3 周疗法，成人总量 150 mg/kg，儿童 200 mg/kg，平分 6 次，一周静脉注射 2 次。次选，经葡萄糖酸锑钠 3 个疗程以上仍未能治愈的黑热患者，可用喷他脒 4 mg/kg，注射前配成 10% 溶液肌内注射，一日 1 次，连用 15 日。

◆ 对症治疗：①严重贫血者须用铁剂及输血，待贫血好转后再用锑剂治疗。②多种治疗无效，仍可查到病原体，脾大明显者，应行脾切除术，术后再用锑剂治疗，以期根治。

◆ 说明：感染严重一个疗程未愈或复发者，可增加剂量重复治疗，在 6 日疗法基础上加大 1/3 量。

9.8.2.2 抗利什曼原虫药

葡萄糖酸锑钠 [基(基)，保(甲)]

Sodium Stibogluconate

【适应证】用于治疗利什曼原虫病。

【注意事项】(1) 肝功能不全者慎用。(2) 治疗过程中有出血倾向，体温突然上升或粒细胞减少、呼吸加速、剧烈咳嗽、水肿、腹水时，应暂停注射。(3) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】肺炎、肺结核者、严重心、肝、肾疾病患者。

【不良反应】与三价锑相仿，但较少而轻，一般患者多能耐受。(1) 一般反应：恶心、呕吐、咳嗽、腹痛、腹泻现象，偶见白细胞减少。(2) 特殊反应：包括肌内注射局部痛、肌痛和关节僵直。后期出现心电图改变（如 T 波低平或倒置、QT 间期时间延长等），为可逆性，但可能为严重心律失常的前奏。肝、肾功能异常者应加强监测。(3) 罕见休克和突然死亡。

【用法与用量】肌内或静脉注射：①成人：一次 6 ml（含五价锑 0.6 g），一日 1 次，连用 6 ~ 10 日；或总剂量按体

重90～130 mg/kg（以50 kg为限），等分6～10次，一日1次。②儿童：总剂量按体重150～200 mg/kg，分为6次，一日1次。对敏感性较差的虫株感染，可重复1～2个疗程，间隔10～14日。对全身情况较差者，可一周注射2次，疗程3周或更长。对新近曾接受锑剂治疗者，可减少剂量。

【制剂与规格】葡萄糖酸锑钠注射液：6 ml（内含五价锑0.6 g，约相当于葡萄糖酸锑钠1.9 g）。

喷他脒[保（甲/乙）]

Pentamidine

【适应证】(1) 仅用于对锑剂有耐药性或不能用锑剂的黑热病（利什曼原虫病）。(2) 卡氏肺孢子菌病（首选药为复方磺胺甲噁唑）。(3) 也可用于治疗早期非洲锥虫病，但对晚期伴中枢神经系统感染的锥虫病患者的疗效差。

【注意事项】(1) 肌内注射后局部可发生硬结和疼痛，偶见形成脓肿。(2) 静脉注射易引起低血压及其他严重的即刻反应。(3) 偶引起肝肾功能损害（均为可逆性）、低血糖或高血糖、焦虑、头晕、头痛、嗜睡等。(4) 在用药期间宜做血糖、肝肾功能、血常规、心电图、血压等监测。(5) 该药可使原有肺结核病灶恶化。(6) 静脉注射易引起低血压以及其他严重即刻反应，某些系统由于组胺释放所致。

【禁忌证】妊娠和哺乳期妇女、血液病、心脏病、糖尿病或低血糖、肝肾功能不全、低血压患者、肺结核患者禁用。

【不良反应】(1) 肌内注射后局部可发生硬结和疼痛，偶见形成脓肿。(2) 静脉注射易引起低血压及其他严重的即刻反应。(3) 治疗早期可有发热及脾大。(4) 可使肺结核病灶恶化。(5) 偶引起可逆性肝肾功能损害、低血糖或高血糖、头晕、头痛、嗜睡等。

【用法与用量】(1) 肌内注射：临用时新鲜配制成10%溶液，做深部肌内注射。一次3～5 mg/kg，一日1次，10～15次为1个疗程。(2) 静脉滴注：上述剂量与5%葡萄糖混合后静滴，一日1次，15～20次为1个疗程，必要时隔1～2周后复治。

【制剂与规格】注射用喷他脒：① 0.2 g；② 0.3 g。

9.8.3 阿米巴病及其药物治疗

阿米巴病是由溶组织阿米巴引起的感染。阿米巴病有两种，即肠阿米巴病（阿米巴痢疾，amebic dysentery）和肠外阿米巴病（包括肝阿米巴病、阿米巴肺脓肿病和阿米巴脑脓肿等）。

9.8.3.1 阿米巴痢疾及其药物治疗

(1) 轻、中度感染

◆ 首选药物：甲硝唑，口服，一次400～600 mg，一日3次，连服10日。以后改为巴龙霉素，口服，一次500 mg，一日3次，连服7日；或双碘喹啉，口服，一次600 mg，一日3次，连服20日。

◆ 次选药物：替硝唑，每12小时口服1 g，连服3日；或奥硝唑每12小时口服500 mg，连服5日。以后改为巴龙霉素，口服，一次500 mg，一日3次，连服7日。

(2) 重度感染

◆ 首选药物：甲硝唑，静脉滴注750 mg，继以口服一次600～800 mg，一日3次，连服15～20日。以后改为巴龙霉素，口服，一次500 mg，一日3次，连服7日。

◆ 次选药物：替硝唑，口服，一日2 g，连服7～10日；以后改为巴龙霉素，口服，一次500 mg，一日3次，连服7日。

9.8.3.2 肠外阿米巴病及其药物治疗

◆ 首选药物：甲硝唑，口服，一次600～800 mg，一日3次，连服10日。替硝唑，口服，一日2 g，连服5日。

◆ 次选药物：氯喹，口服，第1、2日，一日2次，每次300 mg；第3日改为一日2次，每次150 mg，连服20日，必要时可延长。

9.8.3.3 抗阿米巴原虫药

双碘喹啉[保（乙）]

Diiodohydroxyquinoline

【适应证】(1) 治疗轻型或无明显症

状的阿米巴痢疾。(2) 与依米丁、甲硝唑合用,治疗急性阿米巴痢疾及较顽固病例。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者慎用。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(3) 药物对检验值或诊断的影响治疗期间可使蛋白结合碘的水平增高,故能干扰某些甲状腺功能试验。(4) 对肠外阿米巴病(如阿米巴肝脓肿)无效。

【禁忌证】对碘过敏者、甲状腺肿大者、严重肝肾疾病者、神经紊乱者禁用。

【不良反应】(1) 主要的不良反应为腹泻,但不常见,一般在治疗第 2、3 日开始,不需停药,数日后即可自行消失。(2) 还可出现恶心、呕吐。(3) 大剂量可致肝功能减退。(4) 可见瘙痒、皮疹、甲状腺肿大(与药物中含碘有关)。(5) 也可见发热、寒战、头痛和眩晕。

【用法与用量】口服:①成人一次 400 ~ 600 mg,一日 3 次,连服 14 ~ 21 日。②儿童一次 10 mg/kg,一日 3 次,连服 14 ~ 21 日。重复治疗需间隔 15 ~ 20 日。

【制剂与规格】双碘喹啉片:200 mg。

依米丁(依美斯汀)[保(乙)]

Emetine

【适应证】用于治疗阿米巴痢疾和肠外阿米巴病如阿米巴肝脓肿等,主要用于甲硝唑或氯喹无效的患者。

【注意事项】(1) 患者在用药期间应尽量卧床休息,在注射本品前后 2 小时必须卧床休息,注射前测血压和脉搏,血压过低或心率超过每分钟 110 次时暂停注射。(2) 在治疗过程中如出现以上心电图改变或传导阻滞、异位节律时要立刻停药,否则可引发心肌炎而危及生命。(3) 重症及过度衰弱患者剂量宜减半。(4) 应用本品治疗后仍需服用杀灭肠腔内虫体的药物如双碘喹啉等,以求根治。(5) 老年患者的剂量应减少 50%。

【禁忌证】心脏病及肾脏病者、婴幼儿、妊娠期妇女禁用。

【不良反应】(1) 局部反应:注射的部位可有疼痛,有时出现坏死及蜂窝织炎,甚至脓肿。(2) 胃肠道反应:恶心、呕吐、腹泻等。(3) 神经肌肉反应:常见的有肌肉疼痛和无力,特别是四肢和颈部;有时可因全身无力而出现呼吸困难。(4) 心脏反应:低血压、心前区疼痛、心动过速和心律不齐,常是心脏受损的征象。心电图改变尤其是 T 波低平或倒置、QT 间期延长,这些变化提示心肌早期中毒的征象。

【用法与用量】深部皮下或肌内注射:①成人一日 1 mg/kg,一日最大剂量不超过 60 mg,一日 1 次,疗程为 4 ~ 6 日,如需第 2 疗程时必须间隔 6 周。②儿童剂量为一日 1 mg/kg,可分 2 次注射,儿童的疗程不要超过 5 日。

【制剂与规格】盐酸依米丁注射液:① 1 ml : 30 mg;② 1 ml : 60 mg。

二氯尼特

Diloxanide

【适应证】(1) 直接杀死阿米巴原虫,对肠内外阿米巴均有效,可与依米丁或氯喹合用。(2) 为治疗无症状带阿米巴包囊者的首选药。

【注意事项】(1) 对中度或重度肠阿米巴病或肠外阿米巴病常与其他药物联合应用,如阿米巴肝脓肿时本品与甲硝唑合用。(2) 单独使用治疗肠外阿米巴病则无疗效。

【禁忌证】孕妇及 2 岁以下儿童不宜服用。

【不良反应】常见腹胀;偶见恶心、呕吐、腹痛、食管炎、持续性腹泻、皮肤瘙痒、荨麻疹、蛋白尿和含糊的麻刺激感觉,治疗完成后而消失。

【用法与用量】口服:①成人一次 500 mg,一日 3 次,10 日为 1 个疗程。②儿童按体重 30 mg/kg,分 3 次给药,连续 10 日为 1 个疗程。

【制剂与规格】二氯尼特片:① 0.25 g;② 0.5 g。

卡巴胂

Carbarsone

【适应证】用于治疗慢性阿米巴痢疾,也可用于丝虫病等的治疗。

【注意事项】肝、肾功能不全者慎用。

【禁忌证】对胂剂过敏者禁用。

【不良反应】常见胃肠反应,可见粒细胞减少、肝炎、剥脱性皮炎。

【用法与用量】口服：①成人：治疗阿米巴痢疾，一次0.1～0.2g，一日3次，连用10日为1个疗程，必要时可重复；或用其1%溶液（内加2%碳酸氢钠）200 ml，隔天保留灌肠1次，每疗程5次。治丝虫病，一日0.25～0.5 g，分2次，连用10日，常与枸橼酸乙胺嗪合用。②儿童：治疗阿米巴痢疾，一日8 mg/kg，分次服用。其他同成人。

【制剂与规格】卡巴胂 片：① 0.1 g；② 0.2g。

9.8.4 血吸虫病及其药物治疗

血吸虫病（shistosomiasis）是由日本血吸虫所致的感染。

9.8.4.1 急性血吸虫病的药物治疗

吡喹酮，疗程为4～6日。成人疗程总剂量为120 mg/kg（最大量按60 kg计）；儿童疗程总剂量为140 mg/kg。分为2～3次口服。一般病例也可采用一次10 mg/kg，一日3次，连服4日。

9.8.4.2 慢性血吸虫病的药物治疗

吡喹酮，成人疗程总剂量为60 mg/kg或10 mg/kg（最大量按60 kg计），一日3次，连服2日。儿童体重< 30 kg者，疗程总剂量为70 mg/kg，用法同成人。严重感染者可按总剂量90 mg/kg，将每日剂量分为2日服完，每日剂量分为3次口服。

9.8.4.3 晚期血吸虫病的药物治疗

吡喹酮，成人总剂量为40～60 mg/kg分为2日服完，每日剂量分为3次口服。

9.8.4.4 抗血吸虫药

吡喹酮[基（基），保（甲）]

Praziquantel

【适应证】用于各种血吸虫病、华支睾吸虫病、肺吸虫病、姜片虫病、绦虫病及囊虫病。

【注意事项】(1) 治疗寄生于组织内的寄生虫如血吸虫、肺吸虫、囊虫等，由于虫体被杀死后释放出大量的抗原物质，可引起发热、嗜酸性粒细胞增多、皮疹等，偶可引起过敏性休克，必须注意观察。(2) 脑囊虫病患者需住院治疗，并辅以防治脑水肿和降低高颅压（应用地塞米松和脱水剂）或防治癫痫持续状态的治疗措施，以防发生意外。(3) 合并眼囊虫病时，须先手术摘除虫体，而后进行药物治疗。(4) 严重心、肝、肾患者及有精神病史者慎用。(5) 有明显头晕、嗜睡等神经系统反应者，治疗期间与停药后24小时内勿进行驾驶、机械操作等工作。(6) 在囊虫病驱除带绦虫时，需应将隐性脑囊虫病除外，以免发生意外。(7) 哺乳期妇女于服药期间，直至停药后72小时内不宜喂乳。

【禁忌证】眼囊虫病患者。

【不良反应】(1) 常见头晕、头痛、恶心、腹痛、腹泻、乏力、四肢酸痛等，一般程度较轻，持续时间较短，不影响治疗，不需处理。(2) 少数见心悸、胸闷等症状，心电图显示T波改变和期前收缩，偶见室上性心动过速、心房颤动。(3) 少数病例可出现一过性ALT及AST升高。(4) 偶可诱发精神失常或出现消化道出血。

【用法与用量】口服：(1) 治疗吸虫病。①血吸虫病：各种慢性血吸虫病采用总剂量60 mg/kg的1～2日疗法，一日量分2～3次餐间服。急性血吸虫病总剂量为120 mg/kg，一日量分2～3次服，连服4日。体重超过60 kg者按60 kg计算。②华支睾吸虫病：总剂量为210 mg/kg，一日3次，连服3日。③肺吸虫病：25 mg/kg，一日3次，连服3日。④姜片虫病：15 mg/kg，顿服。(2) 治疗绦虫病：①牛肉和猪肉绦虫病：10 mg/kg，清晨顿服，1小时后服用硫酸镁。②短小膜壳绦虫和阔节裂头绦虫病。25 mg/kg，顿服。(3) 囊虫病总剂量120～180 mg/kg，分3～5日服，一日量分2～3次服。

【制剂与规格】吡喹酮片：0.2 g。

9.8.5 丝虫病及其药物治疗

丝虫病（filariasis）是由丝虫（如马来丝虫和斑氏丝虫）感染所致的疾病。

◆ 首选药物：乙胺嗪。①短程疗法。晚上一次顿服1.5 g；或一日一次口服0.75 g，连服2日。适用于体质较强的马

来丝虫感染者。②中程疗法。每日 0.6 g，分 2 ~ 3 次口服，连服 7 日。适用于斑氏丝虫感染者。③间歇疗法。治疗斑氏丝虫感染者，一周口服 1 次，一次 0.5 g，连服 7 周。治疗马来丝虫感染者，一周口服 1 次，一次 0.3 g，连服 6 周。

◆ 次选药物：伊维菌素，一次口服 400 μg/kg。

乙胺嗪[保(甲)]

Diethylcarbamazine

【适应证】(1) 用于治疗斑氏丝虫、马来丝虫和罗阿丝虫感染，经一次或多次治疗后可根治。(2) 用于盘尾丝虫病，因本品不能杀死成虫，故不能根治。(3) 亦可用于热带嗜酸细胞增多症患者。(4) 对蛔虫感染也有效，但已被其他更安全、有效、新的抗蠕虫药所取代。

【注意事项】(1) 用以治疗盘尾丝虫和罗阿丝虫感染时，应从小剂量开始，以减少因虫体破坏而引起的副作用。重度感染的盘尾丝虫病患者，在接受单剂乙胺嗪后，可出现急性炎症反应综合征（Mazzotti 反应），表现为发热、心动过速、低血压、淋巴结炎和眼部炎症反应，多由微丝蚴死亡引起。(2) 在重度罗阿丝虫感染者采用乙胺嗪治疗后可发生脑病和视网膜出血等。预先给肾上腺皮质激素可减少不良反应。(3) 对有活动性肺结核、严重心脏病、肝病、肾病、急性传染病应暂缓治疗。对儿童有蛔虫感染者应先驱除蛔虫。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 偶见食欲减退、恶心、呕吐、头晕、头痛、乏力、失眠、过敏性喉头水肿、支气管痉挛、暂时性蛋白尿、血尿、肝大和压痛等。(2) 治疗期间可有畏寒、发热、头痛、肌肉关节酸痛、皮疹、瘙痒等反应，多由于大量微丝蚴和成虫杀灭后释放异性蛋白所致。(3) 成虫死亡后尚可引起局部反应如淋巴管炎、淋巴结炎、精索炎、附睾炎等，并出现结节。马来丝虫病患者出现的反应常较斑氏丝虫病者为重，血中微丝蚴数多者反应也较重。盘尾丝虫病患者反应亦较严重。

【用法与用量】口服（餐后）：(1) 治疗斑氏和马来丝虫病，国内目前常用。①治疗斑氏绦虫病及重度感染马来绦虫病总量 4.2 g，7 日疗法，即一日 0.6 g，分 2 ~ 3 次服，7 日为 1 个疗程。间隔 1 ~ 2 个月，可应用 2 ~ 3 个疗程。②治疗马来绦虫病可用大剂量短疗程法，即 1 ~ 1.5 g，夜间顿服法，也可间歇服用 2 ~ 3 个疗程。(2) 治疗罗阿丝虫病：宜用小剂量，一次按体重 2 mg/kg，一日 3 次，连服 2 ~ 3 周，必要时间隔 3 ~ 4 周可复治。(3) 治疗盘尾丝虫病：初期剂量宜小，按体重不超过 0.5 mg/kg，第 1 日 1 次，第 2 日 2 次，第 3 日增至 1 mg/kg，日服 3 次，如无严重反应，增至 2 mg/kg，日服 3 次，总疗程 14 日。如初治全身反应严重，可暂停用或减少剂量。必要时可给以糖皮质激素。(4) 预防：在丝虫病流行区，有将乙胺嗪掺拌入食盐中，制成药盐全民食用以杀死血液中微丝蚴，防治效果迅速可靠，为消灭丝虫病传染源的较好措施。

【制剂与规格】枸橼酸乙胺嗪片：① 50 mg；② 100 mg。

伊维菌素

Ivermectin

【适应证】用于盘尾丝虫病和类圆线虫病、钩虫、蛔虫、鞭虫及蛲虫感染。

【注意事项】体重低于 15 kg 的儿童慎用。

【禁忌证】本品过敏者、孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 少见头痛、头晕、腹痛、腹泻、恶心、呕吐、皮疹等。无需特别治疗，停药后自行消失。(2) 用伊维菌素治疗盘尾微丝幼虫的患者可能会出现皮肤和(或)全身严重的变态反应(Mazzotti 反应)及眼科反应。这些反应可能是由于死亡的微丝幼尸体引起的过敏与炎症反应。盘尾丝虫病患者使用本品易产生不良反应。皮疹或瘙痒，以及颈部、腋窝等部位淋巴结肿痛。

【用法与用量】口服：(1) 钩虫感染，14 岁以上者单次口服 12 mg（相当于 0.2 mg/kg）；14 岁以下者单次口服 6 mg。(2) 蛔虫感染，14 岁以上者单次口服 6 mg（相当于 0.1 mg/kg），14 岁以下者单次口服 3 mg。(3) 鞭虫感

第9章 感染疾病用药

染，14岁以上者单次口服12 mg（相当于0.2 mg/kg）；14岁以下者单次口服6 mg。(4) 蛲虫感染，14岁以上者单次口服12 mg（相当于0.2 mg/kg）；14岁以下者单次口服6 mg。(5) 类圆线虫病，推荐剂量是单剂量口服200 μg/kg，用水送服。通常情况下无需加量，但需随访以保证根治。常用剂量如下：① 15～24 kg者，剂量为3 mg；② 25～34 kg者，剂量为6 mg；③ 35～50 kg者，剂量为9 mg；④ 51～65 kg者，剂量为12 mg；⑤ 66～79 kg者，剂量为15 mg；⑥大于80 kg者，剂量为200 μg/kg。(6) 盘尾丝虫病：推荐剂量是单剂量150 μg/kg，用水送服。常用剂量如下：① 15～24 kg者，剂量为3 mg；② 25～44 kg者，剂量为6 mg；③ 45～64 kg者，剂量为9 mg；④ 65～79 kg者，剂量为12 mg；⑤大于80 kg者，剂量为150 μg/kg。

【制剂与规格】伊维菌素片：① 2.5 mg ② 5 mg；③ 6 mg。

伊维菌素片咀嚼片：3 mg。

伊维菌素片胶囊：3 mg。

9.8.6 包虫病及其药物治疗

包虫病（hydatid dusease）又称棘球蚴病（eichinococcosis），是棘球绦虫的幼虫所致的慢性寄生虫病。手术为首选治疗方法，手术前2周至手术后2周服用阿苯达唑以防止播散与复发。其剂量为一日10～20 mg/kg，分2次口服，30日为1个疗程，间隔半个月，继续下1个疗程，可视病情连续3～10个疗程。

9.8.7 吸虫感染及其药物治疗

9.8.7.1 肝片吸虫病（fascioliasis hepatica）及其药物治疗

◆ 病原体：肝片形吸虫。

◆ 首选药物：吡喹酮，一次14 mg/kg，一日3次，连服3日。

◆ 次选药物：阿苯达唑，400 mg，顿服，连服7日。

9.8.7.2 姜片虫病（fasciolopsiasis）及其药物治疗

◆ 病原体：布氏姜片吸虫。

◆ 首选药物：吡喹酮，15 mg/kg，顿服。

9.8.7.3 肺型并殖吸虫病（pulmonry type paragonimiasis）

◆ 病原体：卫氏并殖吸虫。

◆ 首选药物：吡喹酮，一次25 mg/kg，一日3次，连服3日。

◆ 次选药物：硫氯酚，一日3 g，分3次服，连服15日。

9.8.8 肠道线虫病和绦虫病及其药物治疗

肠道线虫病主要包括蛔虫病、蛲虫病、钩虫病、粪类圆线虫病、鞭虫病、旋毛虫病和广州管圆线虫病等。肠道绦虫病主要包括阔节裂头绦虫病、猪带绦虫病、牛带绦虫、囊尾蚴病、短膜壳绦虫病等。

9.8.8.1 蛔虫病（ascariasis）的药物治疗

◆ 病原体：蛔虫。

◆ 首选药物：阿苯达唑，400 mg，顿服。甲苯咪唑，200 mg，顿服。

◆ 次选药物：噻嘧啶，10 mg/kg（或500 mg），睡前顿服，连服2日。左旋咪唑，1.5～2.5 mg/kg，空腹或睡前顿服。

9.8.8.2 蛲虫病（enterobiasis）的药物治疗

◆ 病原体：蛲虫。

◆ 首选药物：阿苯达唑，400 mg，顿服。甲苯咪唑，200 mg顿服。

◆ 次选药物：噻嘧啶，10 mg/kg，睡前顿服，连服7日。

9.8.8.3 钩虫病（ancylostomiasis）的药物治疗

◆ 病原体：钩虫（美洲钩口线虫、十二指肠钩口线虫）。

◆ 首选药物：阿苯达唑，一次400 mg，一日2次，连服3日。甲苯咪唑，一次100 mg，一日2次，连服3日。

◆ 次选药物：噻嘧啶，10 mg/kg（或500 mg），睡前顿服，连服3日。左旋咪唑，1.5～2.5 mg/kg，每晚1次，连服3日。

9.8.8.4 粪类圆线虫病（strongyloidiasis）的药物治疗

◆ 病原体：粪类圆线虫。

◆ 首选药物：阿苯达唑，400 mg，顿服，连服 6 日。

◆ 说明：必要时 2 周后重复给药 1 次。

9.8.8.5 鞭虫病（trichuriasis）的药物治疗

◆ 病原体：鞭虫。

◆ 首选药物：阿苯达唑，一次 400 mg，一日 2 次，连服 3 日。甲苯咪唑，一次 100 mg，一日 2 次，连服 3 日。

◆ 次选药物：噻嘧啶，一次 6 mg/kg，一日 2 次，连服 2 日。

9.8.8.6 旋毛虫病（trichinosis）的药物治疗

◆ 病原体：旋毛虫。

◆ 首选药物：阿苯达唑，一次 400 mg，一日 2 次，连服 7 日。

◆ 说明：对严重感染者加服糖皮质激素。

9.8.8.7 广州管圆线虫病（angiostrongiloidiasis）的药物治疗

◆ 病原体：广州管圆线虫。

◆ 首选药物：阿苯达唑，一日 20 mg/kg，分 3 次服，连服 7 日。

◆ 说明：可合用糖皮质激素以减轻杀虫引起的炎症反应。

9.8.8.8 阔节裂头绦虫病（diphyllobothriasis）的药物治疗

◆ 病原体：阔节裂头绦虫。

◆ 可选药物：吡喹酮，25 mg/kg，顿服。氯硝柳胺，2 g，顿服。

9.8.8.9 猪带绦虫病（taeniasis solium）的药物治疗

◆ 病原体：猪带绦虫。

◆ 首选药物：吡喹酮，10 mg/kg，顿服。氯硝柳胺，一次 1 g，隔 1 小时后再服 1 g，共 2 次。

◆ 次选药物：阿苯达唑，一日 400 ~ 800 mg，连服 3 日。

9.8.8.10 牛带绦虫病（taeniasis saginata）的药物治疗

◆ 病原体：牛带绦虫。

◆ 首选药物：吡喹酮，10 mg/kg，顿服。氯硝柳胺，一次 1 g，隔 1 小时后再服 1 g，共 2 次。

◆ 次选药物：阿苯达唑，一日 400 ~ 800 mg，连服 3 日。

9.8.8.11 囊尾蚴病（cysticercosis cellulosae，囊虫病）的药物治疗

◆ 病原体：囊尾蚴（猪带绦虫幼虫期）。

◆ 首选药物：阿苯达唑，一日 20 mg/kg，分 3 次服，10 日为 1 个疗程，常需 1～3 个疗程。

◆ 次选药物：吡喹酮，一日 50 ~ 60 mg/kg，分 3 次服，3 ~ 5 日为 1 个疗程。

9.8.8.12 短膜壳绦虫病（hymenolepiasis）的药物治疗

◆ 病原体：短膜壳绦虫。

◆ 首选药物：吡喹酮，25 mg/kg，顿服。

◆ 次选药物：氯硝柳胺，第 1 日一次 1 g，隔 1 小时 1 次，共 2 次。第 2 日起一次 1 g，连服 6 ~ 8 日。

◆ 说明：使用氯硝柳胺治疗时必须连续服用 6 日以上以确保完全消灭虫体。

阿苯达唑[基(基)，保(甲)]

Albendazole

【适应证】广谱驱虫药。可用于治疗钩虫、蛔虫、鞭虫、蛲虫、旋毛虫等线虫病，还可用于治疗囊虫和包虫病。

【注意事项】(1) 蛲虫病易自身重复感染，故在治疗 2 周后应重复治疗一次。(2) 脑囊虫患者必须住院治疗，以免发生意外。(3) 合并眼囊虫病时，须先行手术摘除虫体，而后进行药物治疗。(4) 2 岁以下儿童不宜服用。

【禁忌证】(1) 有蛋白尿、化脓性皮炎以及各种急性疾病患者。(2) 严重肝、肾、心脏功能不全及活动性溃疡病患者。(3) 眼囊虫病手术摘除虫体前。(4) 孕妇、哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 少数病例有口干、

乏力、嗜睡、头晕、头痛以及恶心，上腹不适等消化道症状。但均较轻微，不需处理可自行缓解。(2) 治疗囊虫病特别是脑囊虫病时，主要因囊虫死亡释出异性蛋白有关，多于服药后 2 ~ 7 日发生，出现头痛、发热、皮疹、肌肉酸痛、视力障碍、癫痫发作等，须采取相应措施（应用肾上腺皮质激素，降颅压、抗癫痫等治疗）。(3) 治疗囊虫病和包虫病，因用药剂量较大，疗程较长，可出现 ALT 升高，多于停药后逐渐恢复正常。

【用法与用量】口服：(1) 成人：①蛔虫及蛲虫病，一次 400 mg 顿服；②钩虫及鞭虫病，一次 400 mg，一日 2 次，连服 3 日；③旋毛虫病，一次 400 mg，一日 2 次，连服 7 日；④囊虫病，按体重一日 20 mg/kg，分 3 次口服，10 日为 1 个疗程，一般需 1 ~ 3 个疗程，疗程间隔视病情而定，多为 3 个月；⑤包虫病，按体重一日 20 mg/kg，分 2 次口服，疗程 1 个月，一般需 5 个疗程以上，疗程间隔为 7 ~ 10 日。(2) 儿童：12 岁以下儿童用量减半。

【制剂与规格】阿苯达唑片：① 0.1 g；② 0.2 g；③ 0.4 g。

阿苯达唑咀嚼片：0.1g。

阿苯达唑胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g。

阿苯达唑颗粒剂：① 1 g : 0.1 g；② 1 g : 0.2 g。

甲苯咪唑 [保（甲）]

Mebendazole

【适应证】用于蛲虫病、蛔虫病、钩虫病、鞭虫病、粪类圆线虫病、绦虫病的治疗。

【注意事项】(1) 肝肾功能不全者慎用。(2) 甲苯咪唑可使 AST 及 ALT、血尿素氮增高。(3) 少数病例特别是蛔虫感染较重的患者服药后可引起蛔虫游走，造成腹痛或吐蛔虫，甚至引起窒息。此时应加用左旋咪唑等驱虫药以避免发生上述情况。(4) 腹泻者因虫体与药物接触少，故治愈率低，应在腹泻停止后服药。(5) 在动物实验中有致畸作用，因此孕妇禁用，哺乳期妇女应用时应暂停哺乳。(6) 4 岁以上儿童用量同成人剂量，4 岁以下儿童减半。(7) 老年人由于肝、肾功能减退，因此应慎用。

【禁忌证】对甲苯咪唑过敏者、2 岁以下婴幼儿。

【不良反应】因本品吸收少，排泄快，故不良反应较少。(1) 极少数患者有胃部刺激症状，如恶心、腹部不适、腹痛、腹泻等，尚可出现乏力、皮疹。(2) 偶见剥脱性皮炎，全身性脱毛症等，均可自行恢复正常。

【用法与用量】口服：①治疗蛔虫病、蛲虫病，成人，可采用 200 mg 顿服。②治疗鞭虫病、钩虫病，成人，一次 200 mg，一日 2 次，连服 3 日。第 1 个疗程未完全治愈者，3 ~ 4 周后可服用第 2 个疗程。③治疗绦虫病，成人，一次 300 mg，一日 2 次，连服 3 日。④粪类圆线虫病，成人，一次 100 mg，一日 2 次，连服 3 日。

【制剂与规格】甲苯咪唑片：① 50 mg；② 100 mg。

甲苯咪唑胶囊：① 50 mg；② 100 mg。

甲苯咪唑混悬液：2%。

硫氯酚 [保（甲）]

Bithionol

【适应证】(1) 主要用于治疗肺吸虫病，还可用于治疗姜片虫病、绦虫病（牛带绦虫病、猪带绦虫病、微小膜壳绦虫病）。(2) 对肺吸虫囊蚴有明显杀灭作用，临床用于肺吸虫病、牛肉绦虫病、姜片虫病。(3) 对华支睾吸虫病疗效较差。

【注意事项】(1) 消化性溃疡患者、哮喘或变应性疾病患者慎用。(2) 服用本品前宜先驱除肠道寄生虫，以避免用药后引起的吐虫现象。(3) 驱绦虫时，呕吐可使猪带绦虫节片逆流入胃而引起囊虫病，因而应加服小剂量氯丙嗪以防呕吐。

【禁忌证】对本品过敏者，严重心、肝、肾脏疾病患者，孕妇禁用。

【不良反应】(1) 可见头晕、恶心、腹痛、腹泻，偶见皮肤出血点及光敏反应等。(2) 肺型肺吸虫病患者服用本品，可加重其咳嗽、咳痰、咯血。治疗脑型肺吸虫病，必要时可使用皮质激素治疗。(3) 少数可引起中毒性肝炎。

【用法与用量】口服：一日 50 ~ 60 mg/kg（成人与小儿同）。①肺吸虫病及华支睾吸虫病，可将全日量分 3 次服，隔日服药，疗程总量 30 ~ 45 g。②姜片虫病，可于睡前半空腹将 2 ~ 3 g 药物一次服完。③牛肉绦虫病，可将总量（50 mg/kg）分 2 次服，间隔半小时，服完第 2 次药后 3 ~ 4 小时服泻药。

【制剂有规格】硫氯酚片：250 mg。

硫氯酚胶囊：500 mg。

氯硝柳胺[保（乙）]

Niclosamide

【适应证】用于人体和动物绦虫感染，是治疗牛带绦虫、短小膜壳绦虫、阔节裂头绦虫等感染的良好药物。对猪带绦虫亦有效，但服药后有增加感染囊虫病的可能性。

【注意事项】(1) 用以治疗猪肉绦虫时，在服药前加服镇吐药，服药后 2 小时，服硫酸镁导泻，以防节片破裂后散出的虫卵倒流入胃及十二指肠内造成自体感染囊虫病的危险。(2) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。(3) 儿童用药可研碎用少量温开水送下。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】偶见疲乏、头晕、胸闷、胃肠道功能紊乱、发热、瘙痒等。

【用法与用量】口服：①成人，驱牛带绦虫和猪带绦虫，一次 1 g，空腹嚼碎后服下，隔 1 小时再服 1 g，2 小时后导泻，并可进食；驱短小膜壳绦虫，初剂 2 g，继以一日 1 g，连服 6 日，必要时间隔 1 个月后复治。②儿童，驱牛带绦虫和猪带绦虫，体重 10 ~ 35 kg，1 次服 1 g，体重 <10 kg，一次 0.5 g，空腹嚼碎后服下，隔 1 小时再服一次，2 小时后导泻，并可进食；驱短小膜壳绦虫，2 ~ 6 岁，一日服 1 g，<2 岁一日服 0.5 g，连服 6 日，必要时间隔 1 个月后复治。

【制剂与规格】氯硝柳胺片：0.5 g。

氯硝柳胺胶囊：0.5 g。

哌嗪[保（乙）]

Piperazine

【适应证】用于蛔虫和蛲虫感染。

【注意事项】(1) 营养不良或贫血者应先予纠正，然后再服用。(2) 本品可使血清尿酸数值降低而影响检测结果，对骨髓白细胞有分裂活性。(3) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。(4) 本品对儿童具有潜在的神经肌肉毒性，应避免长期或过量服用。

【禁忌证】对本品有过敏史者、肝肾功能不全者、有神经系统疾病者。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、腹泻、头痛、感觉异常、荨麻疹等，停药后很快消失。过敏者可发生流泪、流涕、咳嗽、眩晕、嗜睡、哮喘等。罕见白内障形成、溶血性贫血（见于葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶缺乏者）等较罕见。

【用法与用量】口服：无需禁食，除便秘者外无需加导泻药。(1) 成人：①驱蛔虫，一次 3 ~ 3.5 g，睡前顿服，连服 2 日。②驱蛲虫，一日 2 ~ 2.5 g，2 次分服，连服 7 ~ 10 日。(2) 儿童：①驱蛔虫，按体重一次 0.15 g/kg，一日量不超过 3 g，睡前顿服，连服 2 日。②驱蛲虫，按体重一日 60 mg/kg，2 次分服，一日量不超过 2 g，连服 7 ~ 10 日。

【制剂与规格】枸橼酸哌嗪片：① 0.25 g；② 0.5 g。

磷酸哌嗪片：① 0.2 g；② 0.5 g。

枸橼酸哌嗪糖浆：16%。

磷酸哌嗪宝塔糖：0.2 g。

三苯双脒

Tribendimidine

【适应证】用于治疗钩虫、蛔虫、鞭虫、蛲虫等感染。

【注意事项】(1) 伴有严重肝、肾功能不全者慎用。(2) 本品不能掰开或咬碎服用。(3) 尚无孕妇及哺乳期妇女、儿童及老年患者用药的资料。

【禁忌证】对本品成分过敏者、心脏病患者或心电图异常者。

【不良反应】可见恶心、腹痛、腹泻、头晕、头痛、困倦，程度较轻，无需特殊处理。

【用法与用量】口服：成人，钩虫感染，0.4 g，一次顿服；蛔虫感染，0.3 g，一次顿服。

【制剂与规格】三苯双脒肠溶片：①0.1 g；②0.2 g；③0.3 g。

噻嘧啶

Pyrantel

【适应证】用于治疗蛔虫病、蛲虫病、十二指肠钩虫病等。

【注意事项】(1) 冠心病、严重溃疡病、肾脏病患者慎用。(2) 营养不良、贫血的患者应先给予支持疗法，然后应用本品。(3) 服用本品无需空腹，也不需导泻。

【禁忌证】1岁以下小儿、妊娠期妇女、肝功能不全者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、食欲减退、腹痛和腹泻等消化道症状。少见头痛、眩晕、嗜睡、胸闷、皮疹等，一般为时短暂，可以忍受，不需处理。偶见ALT及AST升高。

【用法与用量】(1) 口服：①成人常用量，蛔虫病，一次按体重10 mg/kg（一般为500 mg）顿服，一日1次，疗程1～2日；钩虫感染，剂量同上，连服3日；蛲虫感染，一日按体重5～10 mg/kg，连服7日。②小儿常用量，蛔虫病，一日按体重10 mg/kg，睡前顿服，连服2日；钩虫病，剂量同上，连服3日；蛲虫病，一日按体重10 mg/kg，睡前顿服，连服1周。(2) 直肠给药：①栓剂，一次1枚，一日1次，睡前使用，连续3～5日。使用时将塑料包装从下端缺口处撕开，取出栓剂，将栓剂下端轻轻塞入肛门，并按住肛门片刻以防栓剂滑出。②软膏剂，每晚睡前以温水洗净肛门周围，先挤出软膏少许涂于肛门周围，再轻轻插入肛内挤出软膏1～1.5g即可。

【制剂与规格】双羟萘酸噻嘧啶片：①0.3 g（含噻嘧啶104 mg）；②360 mg（含噻嘧啶125 mg）。

双羟萘酸噻嘧啶颗粒：1 g：0.15 g（每1 g含双羟萘酸噻嘧啶0.15 g）。

双羟萘酸噻嘧啶宝塔糖：0.2 g。

双羟萘酸噻嘧啶肛用软膏：3%。

双羟萘酸噻嘧啶栓：0.2 g。

左旋咪唑

Levamisole

【适应证】(1) 对蛔虫、钩虫、蛲虫和粪类圆线虫病有较好疗效。由于本品单剂量有效率较高，故适于集体治疗。(2) 对班氏丝虫、马来丝虫和盘尾丝虫成虫及微丝蚴的活性较乙胺嗪为高，但远期疗效较差。

【注意事项】(1) 类风湿关节炎患者服用后易诱发粒细胞缺乏症。(2) 舍格伦综合征患者慎用。(3) 类风湿关节炎和舍格伦综合征患者接受左旋咪唑治疗，第1周一日50 mg、第2周一日100 mg、第3周一日150 mg后，多数发生不良反应，如红斑、丘疹、关节痛加重伴肿胀、肌痛、流感症候群、失眠、神志混乱等，再予以攻击量后，上述症状又可重现。(4) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】肝肾功能不全者、肝炎活动期患者、妊娠妇女早期、原有血吸虫病者。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、腹痛等。(2) 少见味觉障碍、疲惫、头晕、头痛、关节酸痛、神志混乱、失眠、发热、流感样症候群、血压降低、脉管炎、皮疹、光敏性皮炎等。(3) 偶见蛋白尿，个别可见粒细胞减少、血小板减少，少数甚至发生粒细胞缺乏症（常为可逆性），常发生于风湿病或肿瘤患者。(4) 可引起即发型和Arthus过敏反应，可能系通过刺激T细胞而引起的特应性反应。(5) 个别病例可出现共济失调，感觉异常或视物模糊。

【用法与用量】(1) 口服：①用于驱蛔虫，成人1.5～2.5 mg/kg，空腹或睡前顿服，小儿剂量为2～3 mg/kg；②用于驱钩虫，1.5～2.5 mg/kg，每晚1次，连服3日；③治疗丝虫病，4～6 mg/kg，分2～3次服，连服3日。(2) 直肠给药：①治疗蛲虫、蛔虫病，1岁内用50 mg，3岁内用75 mg，5岁内用100 mg，10岁内用150 mg，一日1次，连用3日为1个疗程。②治疗钩虫病，1～4岁用25 mg，5～12岁用50 mg，13～15岁用100 mg，一次1粒，一日1次，连用3日为1个疗程。

【制剂与规格】盐酸左旋咪唑片：① 5 mg；② 25 mg；③ 50 mg。

盐酸左旋咪唑肠溶片：① 25 mg；② 50 mg。

盐酸左旋咪唑颗粒：10 g：50 mg。

盐酸左旋咪唑糖浆：① 100 ml：0.8 g；② 500 ml：4.0 g；③ 2 000 ml：16.0 g。

盐酸左旋咪唑栓：① 50 mg；② 100 mg；③ 150 mg。

阿托伐醌

Atovaquone

【适应证】用于轻中度不能耐受复方磺胺甲噁唑片的肺孢子菌肺炎。

【注意事项】(1) 腹泻和进食困难可降低药物吸收率。(2) 其他原因引起的肺部疾病需查找病因并进行治疗。(3) 老人及肝、肾功能不全者慎用。

【禁忌证】孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】可见恶心、呕吐、腹泻、中性粒细胞减少、皮疹等。

【用法与用量】口服：成人一次750 mg，一日2次，21日为1个疗程，儿童剂量（14个月以上）为一日40 mg/kg。体重超过40 kg的儿童剂量按成人剂量。

【制剂与规格】阿托伐醌混悬液：5 ml：750 mg。

第10章 肿瘤用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 非小细胞肺癌
- 小细胞肺癌
- 乳腺癌
- 胃癌
- 大肠癌
- 食管癌
- 胰腺癌

肿瘤（tumor）是机体在各种致癌因素长时间作用下，组织细胞在基因水平上失去对生长的正常调控，导致其克隆性异常增生而形成的新生物。一般将肿瘤分为良性和恶性两大类。

10.1 肿瘤的综合治疗

肿瘤的病因、发病机制、临床症状及患者的身体状况均十分复杂，单一的治疗方法效果一般并不理想，需要合理的、有计划地联合应用多种治疗手段，取长补短。综合治疗就是根据患者的机体状况、肿瘤的病理类型、侵犯范围（病期）和发展趋势，有计划地、合理地应用现有的治疗手段，以期较大幅度地提高治愈率和延长生存期，提高患者的生活质量。综合治疗手段包括手术、放射、化疗药物、免疫、心理和中医药治疗。在化学治疗时仍然宜联合使用不同药理作用机制的抗肿瘤药组成联合化疗方案，杀灭肿瘤细胞或干扰其生长和代谢。

10.1.1 抗肿瘤药的作用机制和分类

抗肿瘤药（antitumor drugs）是可抑制肿瘤细胞生长，对抗和治疗恶性肿瘤的药物。

过去的药理学曾把抗肿瘤药依据其性质和来源分为6类，即烷化剂、抗代谢药物、抗生素、植物药、激素和杂类。但以上分类不能代表药物的作用机制，来源相同的药物可能作用机制完全不同。所以，目前多根据其作用机制分为以下4类。

10.1.1.1 细胞毒类药

（1）作用于DNA化学结构的药物

①烷化剂：如氮芥、环磷酰胺和噻替派等，能与细胞中的亲核集团发生烷化反应。DNA中鸟嘌呤NT易被烷化，使DNA复制中发生核碱基错误配对。受烷化的鸟嘌呤可以从DNA链上脱失，引起密码解释错乱。双功能基的烷化剂常与DNA双链上各一鸟嘌呤结合形成交叉联结妨碍DNA复制，也可使染色体断裂。DNA结构功能的破坏可导致细胞分裂，增殖停止或死亡。少数受损细胞的DNA可修复而存活下来，引起抗药。

②铂类化合物：铂类金属化合物如顺铂（DDP）可与DNA结合，破坏其结构与功能。

③蒽环类：可嵌入DNA碱基对之间，干扰转录过程，阻止mRNA的形成，如柔红霉素（DNR）、多柔比星（ADM）、表柔比星（EPI）、吡柔比星（THP）及米托蒽醌等，都是临床上有效的蒽环类化合物。放线菌素D（ACD）也属此类药等。

④破坏DNA的抗生素，如丝裂霉素（MMC）的作用机制与烷化剂相同，博来霉素（BLM）可使DNA单链断裂而抑制肿瘤的增殖。

（2）干扰核酸生物合成的药物：属于细胞周期特异性抗肿瘤药，分别在不同环节阻止DNA的合成，抑制细胞分裂增殖，属于抗代谢药。根据药物主要干扰的生化步骤或所抑药的靶酶的不同，可进一步分为：①二氢叶酸还原酶抑制药（抗叶酸剂），如甲氨蝶呤（MTX）等；②胸苷酸合成酶抑制药，影响尿嘧啶核苷的甲基化（抗嘧啶剂），如氟尿嘧啶（5-FU），喃氟尿嘧啶（FT207）及优福定（UFT）等；③嘌呤核苷酸互变抑制药（抗嘌呤剂），如巯嘌呤（6-MP），6-硫鸟嘌呤（6-TG）等；④核苷酸还原酶抑制药，如羟基脲（HU）；⑤DNA多聚酶抑制药，如阿糖胞苷（AraC）等。

（3）作用于核酸转录药物：作用于核酸转录药物包括放线菌素D、阿克拉霉素和普拉霉素，均是由微生物所产生的抗肿瘤药，为细胞周期非特异药，对处于各周期时相的肿瘤细胞均有杀灭作用。

（4）拓扑异构酶抑制药：直接抑制拓扑异构酶，阻止DNA复制及抑制RNA合成。包括拓扑异构酶Ⅰ抑制药和拓扑异构酶Ⅱ抑制药，拓扑异构酶Ⅰ抑制药的代表药有依立替康、拓扑替康、羟喜树碱；拓扑异构酶Ⅱ抑制药的代表药有依托泊苷、替尼泊苷。

（5）干扰有丝分裂的药物

①影响微管蛋白装配的药物，干扰有丝分裂中纺锤体的形成，使细胞停止于分裂中期，如长春新碱（VCR）、长春碱（VLB）、紫杉醇及秋水仙碱等。

②干扰核蛋白体功能阻止蛋白质合成的药物，如高三尖杉酯碱。

③影响氨基酸供应阻止蛋白质合成的药物如门冬酰胺酶；可降解血中门冬酰胺，使瘤细胞缺乏此氨基酸，不能合成蛋白质。

10.1.1.2 改变机体激素平衡而抑制肿瘤的药物（激素类）

与激素相关的肿瘤如乳腺癌、前列腺癌，子宫内膜癌等可通过激素治疗或内分泌腺的切除而使肿瘤缩小。这说明这些起源于激素依赖性组织的肿瘤，仍部分地保留了对激素的依赖性和受体。通过内分泌或激素治疗，直接或间接通过垂体的反馈作用，改变原来机体的激素平衡和肿瘤生长的内环境，可以抑制肿瘤的生长。另一类药物如他莫昔芬则是通过竞争肿瘤表面的受体干扰雌激素对乳腺癌的刺激。而肾上腺皮质激素则可通过影响脂肪酸的代谢而引起淋巴细胞溶解，因之对急性白血病和恶性淋巴瘤有效。激素类药包括雌、孕、

雄激素和拮抗药。

10.1.1.3 生物反应调节药

生物反应调节药是一类具有广泛生物学活性和抗肿瘤活性的生物制剂，对机体的免疫功能有增强、调节作用。主要通过增强机体免疫发挥抗肿瘤作用。

10.1.1.4 单克隆抗体

利用基因工程技术所生产的抗肿瘤单克隆抗体（monoclonal antibody）已近千种，利妥昔单抗、曲妥珠单抗、西妥昔单抗、贝伐单抗等，通过对受体的高选择亲和性，通过抗体依赖性的细胞毒作用，来杀灭肿瘤细胞或抑制肿瘤细胞增殖。

10.1.1.5 作用于转导的抑制药

通过阻断或抑制细胞内信息转导通路的小分子化合物，目前临床应用最多的是酪氨酸激酶抑制药（TKI），分为单靶点和多靶点抑制药。

10.1.2 抗肿瘤药的合理应用

（1）临床医师必须熟知抗肿瘤药的抗瘤谱、药动学、不良反应、药物相互作用，使用规范，合理地应用抗肿瘤药。

（2）周期非特异性药物对癌细胞的作用较强而快，高浓度下能迅速杀灭癌细胞；周期特异性药物的作用需要一定时间才能发挥其杀伤作用。周期非特异性药物的剂量反应曲线接近直线，在机体能耐受的毒性限度内，其杀伤能力随剂量的增加而增加。在浓度和时限的关系中，浓度是主要因素。周期特异性药物则不然，其剂量反应曲线是一条渐近线，即在小剂量时类似于直线，达到一定剂量后不再上升，出现平台。相对来说，在影响疗效的浓度与时间的关系中，时间是主要的因素。因此，为使化疗药物能发挥最大的作用，非特异性药物宜静脉一次性注射，而特异性药物则以缓慢滴注、肌内注射或口服为宜。

（3）联合化疗方案中一般应包括两类以上药理作用机制不同的药物，且常用周期非特异性药物与作用于不同时相的周期特异性药物配合。选药时也要尽可能使各药的毒性不相重复，以提高正常细胞的耐受性。

（4）经典的肿瘤治疗追求扩大根治的手术、强化或冲击化疗、根治性放疗等，然而往往事与愿违。迄今为止，上述治疗所能达到的最高疗效仅仅是临床治愈，肿瘤的复发和转移仍是一个难以解决的问题，且患者治疗后普遍出现生活质量下降，甚至因不能耐受继续治疗而死亡。随着治疗手段的进步，使癌症治疗出现了质的飞跃，已经有可能将肿瘤当成慢性病对待，就像糖尿病、高血压等慢性病那样，肿瘤患者也可带瘤长期生存。对中晚期肿瘤患者应以“提高患者生活质量，延长生命时间”为目标进行综合治疗。

（5）靶向药物的应用应通过相应的靶点合理应用，包括与放化疗并用式序贯应用等。

10.1.3 抗肿瘤药的主要不良反应与防治原则

抗肿瘤药的不良反应涉及以下几方面。

（1）骨髓抑制：表现在白细胞计数、血小板、红细胞计数和血红蛋白下降。除长春新碱和博来霉素外几乎所有的细胞毒药，均会导致骨髓抑制。骨髓抑制常常出现在给药后的 7 ～ 10 日，但是某些药物可出现得更晚，如卡莫司汀、洛莫司汀和美法仑。因此，在每次治疗前必须检查外周血象。如骨髓功能尚未恢复，应酌情减少用药剂量或推迟治疗时间。对中性粒细胞减少、或由此带来的发热患者，应当在化疗停用至少 2 日后应用重组粒细胞集落刺激因子（G-CSF），必要时考虑给予抗菌药物治疗。

（2）消化道反应：包括食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、腹痛、腹胀、肝脏毒性等。对轻度消化道反应可口服多潘立酮、甲氧氯普胺进行处理，如效果不佳，可合并应用地塞米松或劳拉西泮作为补充。对严重呕吐或处理效果不佳者，可给予 5- 羟色胺$_3$（$5HT_3$）受体拮抗药，包括昂丹司琼、格拉司琼、雷莫司琼、托烷司琼；对化疗后的急性或延迟性恶心、呕吐发作者，也可给予神经激肽受体拮抗药阿瑞吡坦，提高对恶心和呕吐的控制。为预防迟发症状，可口服地塞米松，可以单独使用，或与甲

氧氯普胺、苯海拉明联合应用。

(3) 口腔黏膜反应：如咽炎、口腔溃疡、口腔黏膜炎，黏膜反应是肿瘤化疗中常见的一种并发症，多数情况都与氟尿嘧啶、甲氨蝶呤和蒽环类抗生素有关。防止和处理这些并发症，应进行有效的口腔护理（经常洗漱口腔）。

(4) 脱发：抗肿瘤药引起的脱发一般在 1 ~ 2 周后产生。对于脱发，迄今尚无药理学上的防治方法，国外曾探索使用冰帽等措施。

(5) 神经系统毒性：如奥沙利铂、长春碱类及紫杉类可致周围神经炎，应进行积极预防和处理。

(6) 高尿酸血症：化疗可诱导高尿酸血症，且与急性肾衰竭有关。为防止出现，别嘌醇应在治疗肿瘤化疗前 24 小时开始使用，且应大量补充水分。

(7) 大多数细胞毒类药物都有致畸性，对妊娠及哺乳期妇女禁用或慎用。

(8) 静脉注射药物的外渗：绝大部分化疗药物对皮肤、皮下组织、黏膜及血管有明显的刺激，给患者带来痛苦，甚至可造成皮下组织坏死。因此，在使用化疗药物时，应注意做好注射部位血管外渗的防护和处理，减少药物血管外渗的风险。①化疗应当由具有资质的专业人员操作。②当化疗药渗漏时，应即停止注射。③根据化疗药的特性采取相应的防治措施。一般可用 1% 普鲁卡因注射液局部封闭，局部进行冷敷（禁忌热敷），减轻皮肤坏死的机会。④局部使用解毒药是蒽环类化疗药外渗处理的重要环节，根据药物渗出量、范围做局部皮下封闭，即由疼痛或肿胀区域行多点注射。地塞米松 5 mg 加利多卡因 100 mg 局部封闭，一日 1 次，连续 3 日，以减轻局部疼痛和炎症反应。给予 50 ~ 200 mg 氢化可的松琥珀酸钠或 8.4% 碳酸氢钠 5 ml 加地塞米松 4 mg，局部静脉注射或渗漏部位多处皮下注射；透明质酸酶 300 U 加 0.9% 氯化钠注射液 2 ml 局部注射，或透明质酸酶 2 ml 加地塞米松 5 mg 加 5% 利多卡因 2 ml 局部注射。

(9) 泌尿道上皮毒性：出血性膀胱炎是泌尿系统毒性的表现，使用异环磷酰胺及大剂量环磷酰胺时会出现，是由于代谢物丙烯醛所致。美司钠可防止泌尿道毒性的发生。美司钠在使用异环磷酰胺中作为常规治疗措施，也用于使用大剂量环磷酰胺的患者（如超过 2 g），或既往使用环磷酰胺曾经出现泌尿道上皮毒性的患者。

(10) 分子靶向药物的不良反应：靶向药物的不良反应和细胞毒类化疗药物不同，但必须注意靶向治疗药物并不是没有不良反应。虽然靶向药物和化疗比较不良反应不同，发生率相对较低，但也有些可以十分严重甚至难于恢复。所以，靶向药物导致的一些特殊的不良反应也已经在临床上引起广泛关注，特别是皮肤反应、间质性肺疾病（ILD）和心血管不良反应。皮肤反应最多见于作用于 EGFR 的药物，包括表皮生长、恢复不良导致的皮疹、龟裂和疼痛，色素沉着等，由于多发生于手足掌因之称作手足综合征。例如吉非替尼和厄罗替尼的皮疹。心血管不良反应主要包括以下 4 类：高血压、左心室射血分数（LVEF）下降、心肌缺血 / 梗死和 Q-Tc 间期延长。心血管不良反应可以发生于多数靶向药物包括曲妥珠单抗、贝伐单抗和一些与血管内皮生长因子（VEGF）有关的酪氨酸激酶抑制药。间质性肺疾病多发生于作用 EGFR 的小分子化合物，但某些单抗尤其是多次应用也可以发生，一旦发生需要及早停止靶向药物并积极应用高剂量皮质激素治疗。化疗导致的中枢和周围神经系统的不良反应已经为大家熟知。最近人们开始注意到有些靶向药物长期应用也可以导致神经系统毒性，虽然不很常见但一旦发生常常很严重。这些反应包括多灶性脑白质病变（multifocal leukoencephalopathy），进展性和可逆性后脑白质病变综合征（progressive and reversible posterior leukoencephalopathy syndrome）。

靶向治疗特别是利妥昔单抗导致的免疫抑制可以导致严重的不良事件，文献中报道已经很多。我国患过肝炎的人很多，对于应用本品的患者必须注意检查是否有活动性肝炎，以免导致肝炎暴发。

10.1.4 抗肿瘤药的进展

肿瘤内科治疗水平的明显提高，使得

肿瘤内科治疗已成为肿瘤综合治疗中最重要的方法之一。经过近半个世纪的努力，肿瘤内科治疗已取得了长足进步，单纯的肿瘤内科治疗就可以完全治愈某些肿瘤。尽管肿瘤内科治疗取得了长足的进步，但肿瘤内科治疗仍只是当前综合治疗的手段之一。它必须与其他方法，特别是外科手术、放疗及其他生物或物理的手段结合，才能发挥其最佳作用。肿瘤综合治疗是一个系统工程，肿瘤内科治疗的实施也需要全面综合考虑。肿瘤科医生应对肿瘤的类型、特性、分期及发展趋势，患者的身体状况进行详细的了解，并考虑到患者的生理与心理以及社会经济状况，根据现有的治疗手段制定合理的治疗方案，延长患者的生存时间，提高生活质量，使肿瘤患者获得最大的收益。

近年来，伴随着生命科学研究的飞速进展，恶性肿瘤细胞内的信号转导、细胞凋亡的诱导、血管生成以及细胞与胞外基质的相互作用等各种基本过程正渐被阐明。以一些与肿瘤细胞分化增殖相关的细胞信号转导通路的关键酶作为药物筛选靶点，发现选择性作用于特定靶位的高效、低毒、特异性强的新型抗癌药，即分子靶向药和抗体靶向药，已成为当今抗肿瘤药研发的重要方向。

10.2 抗肿瘤治疗方案

10.2.1 非小细胞肺癌治疗方案

10.2.1.1 辅助化疗方案

(1) 顺铂：75 mg/m^2，静脉滴注，第1日（或总量分3日给予）；长春瑞滨：25 mg/m^2，静脉滴注，第1、8日；21日重复1次，共化疗4个周期。

(2) 顺铂：100 mg/m^2，静脉滴注，第1日；依托泊苷：100 mg/m^2，静脉滴注，第1、2、3日；28日重复1次，共化疗4个周期。

(3) 顺铂：80 mg/m^2，静脉滴注，第1日；长春碱：4 mg/m^2，静脉注射或静脉冲入，第1、8、15日；21日重复，共化疗4个周期。

辅助化疗的目的是减少复发转移的风险，辅助化疗仍有不良反应，应充分评估治疗的利弊，术后一般身体状况较差的患者应慎用辅助化疗。

10.2.1.2 化、放疗同步治疗方案

(1) 顺铂：50 mg/m^2，静脉滴注，第1、8日；依托泊苷：100 mg/m^2，静脉滴注，第1～5日；28日为1个疗程，同步进行胸部放疗。

(2) 顺铂：100 mg/m^2，静脉滴注，第1、29日；长春碱：5 mg/m^2，静脉注射或静脉冲入，一周1次，连续5次；同步进行胸部放疗。

(3) 紫杉醇：45～50 mg/m^2，静脉滴注1小时，一周1次；卡铂：200～400 mg/m^{2}或AUC=2，静脉滴注0.5小时，4周1次；同步进行胸部放疗。

10.2.1.3 晚期非小细胞肺癌化疗方案

(1) 长春瑞滨：25 mg/m^2，静脉滴注，第1、8日；顺铂：75 mg/m^2，静脉滴注，第1日（或总量分3日给予）；可酌加抗血管生成药，每21日重复1次，一般化疗4～6个周期。

(2) 吉西他滨：1 000～1 250 mg/m^2，静脉滴注，第1、8日；顺铂：75 mg/m^2，静脉滴注，第1日（或总量分3日给予）；可酌加抗血管生成药，21日重复1次，一般化疗4～6个周期。

(3) 多西他赛：60～75 mg/m^2，静脉滴注，第1日；顺铂：75 mg/m^2，静脉滴注，第1日（或总量分3日给予）；可酌加抗血管生成药，21日重复1次，一般化疗4～6个周期。

(4) 紫杉醇：135 mg/m^2，静脉滴注，第1日；卡铂：200～400 mg/m^{2}或AUC=5～6，静脉滴注0.5小时，第1日；可酌加抗血管生成药，21日重复1次，一般化疗4～6个周期。

(5) 培美曲塞：500 mg/m^2，静脉滴注，第1、8日；顺铂：70～75 mg/m^2，静脉滴注，第1日需按要求补充维生素B_{12}及叶酸。一般21日重复1次，4周期为1个疗程。

晚期肺癌患者的化疗为姑息性的治疗，应充分评估化疗后的利弊，防止出现过度治疗。治疗中应考虑患者病理类型(例

如腺癌多选择培美曲塞等，而鳞癌宜选择吉西他滨等）、发展趋势，以及患者身体状况等因素。

10.2.1.4 二线治疗方案

（1）二线化疗方案

①多西他赛：60 ~ 75 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；21 日重复 1 次。

②培美曲塞：500 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；21 日重复。

（2）二线分子靶向治疗方案

①吉非替尼：每日 250 mg，口服。

②埃罗替尼：每日 150 mg，口服。

10.2.1.5 老年晚期及一般状况差（PS=2）非小细胞肺癌化疗方案

（1）长春瑞滨：25 mg/m^2，静脉冲入，第 1、8、15 日；28 日重复 1 次，共化疗 4 ~ 6 个周期。

（2）吉西他滨：1 000 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8、15 日；28 日重复 1 次，共化疗 4 ~ 6 个周期。

（3）紫杉醇：45 ~ 50 mg/m^2 或多西他赛 60 ~ 75 mg/m^2 治疗，28 日重复 1 次，共化疗 4 ~ 6 个周期。

（4）吉非替尼：250 mg，口服，一日 1 次。

（5）埃罗替尼：150 mg，口服，一日 1 次。

老年患者的治疗应把握度，防止过度治疗给患者带来的伤害。

10.2.2 小细胞肺癌治疗方案

（1）顺铂：75mg/m^2，静脉滴注第 1 日（或总量分 3 日给予）；（或铂 300 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日）；依托泊苷 100 mg/m^2，静脉滴注，第 1、2、3 日；21 日重复，一般化疗 4 ~ 6 个周期。

（2）环磷酰胺 500 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；多柔比星 50 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；长春新碱 1.4 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；21 日重复，一般化疗 4 个周期。

10.2.3 乳腺癌治疗方案

10.2.3.1 术后辅助化疗的方案

（1）环磷酰胺：600 mg/m^2，静脉注射，第 1、8 日；甲氨蝶呤：40 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；氟尿嘧啶：600 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；4 周重复 1 次，共 6 个周期。

（2）含蒽环类联合辅助化疗方案，常用方案如下。

①多柔比星：60 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；环磷酰胺：600 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；3 周重复静脉滴注 1 次，共 6 个周期。

②多柔比星：50 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；环磷酰胺：500 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；氟尿嘧啶：500 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；3 周重复 1 次，共 6 个周期。

③表柔比星：75 ~ 100 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；环磷酰胺：500 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；氟尿嘧啶：500 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；3 周重复 1 次，共 6 个周期。

（3）含紫杉类药物方案：

①环磷酰胺 600 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；多柔比星 60 mg/m^2，（或表柔比星 90 ~ 100 mg/m^2），静脉注射，第 1 日；2 ~ 3 周重复 1 次，共 4 个周期；接着用紫杉醇 175 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；2 ~ 3 周重复 1 次，共 4 个周期（也可用多西他赛 75 ~ 100 mg/m^2，静脉滴注，3 周重复 1 次，共 4 个周期）。

②多西他赛 75 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；环磷酰胺 600 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；3 周重复 1 次，共 4 ~ 6 个周期。

（4）含曲妥珠单抗方案

用于 HER2（人表皮生长因子受体 2）阳性乳腺癌的术后辅助治疗。曲妥珠单抗可与紫杉类药物、非蒽环类药物方案联合使用，也可在化疗结束后使用。一般推荐使用时间为 1 年。曲妥珠单抗：化疗期间 4 mg/kg，静脉滴注 1.5 小时，第 1 日，之后 2 mg/kg，静脉滴注 0.5 小时，一周 1 次；化疗结束后改为 6 mg/kg，静脉滴注 1.5 小时，3 周 1 次，直至 1 年。

10.2.3.2 晚期乳腺癌单药治疗方案

（1）多柔比星：60 ~ 75 mg/m^2，静脉注射，第 1 日，21 日为 1 个周期；或 20 mg/m^2，静脉注射，一周 1 次。

（2）表柔比星：60 ~ 90 mg/m^2，静脉注射，第 1 日，21 日为 1 个周期。

（3）脂质体多柔比星：35 ~ 45 mg/m^2，静脉冲入，第 1 日，28 日为 1 个周期。

（4）紫杉醇：175 mg/m^2，静脉滴注 3 小时，第 1 日，21 日为 1 个周期；或 80 mg/m^2，静脉滴注，一周 1 次。

（5）多西他赛：75 ~ 100 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日，21 日为 1 个周期；或 40 mg/m^2，静脉滴注，一周 1 次，连续 6 周停 2 周为 1 个周期。

（6）长春瑞滨：25 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8、15 日，28 日为 1 个周期。

（7）卡培他滨：1 000 ~ 1 250 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，21 日为 1 个周期。

（8）吉西他滨：800 ~ 1 200 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8、15 日，28 日为 1 个周期。

10.2.3.3 晚期乳腺癌联合化疗方案

（1）环磷酰胺：100 mg/m^2，口服，第 1 ~ 14 日；多柔比星：30 mg/m^2，静脉注射，第 1、8 日；氟尿嘧啶：500 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；28 日为 1 个周期。

（2）氟尿嘧啶：500 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；多柔比星：50 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；环磷酰胺：500 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；21 日为 1 个周期。

（3）多柔比星：60 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；环磷酰胺：600 mg/m^2，静脉注射，第 1 日；21 日为 1 个周期。

以上含多柔比星方案，也可考虑用表柔比星或 THP 代替多柔比星，表柔比星剂量为 80 mg/m^2，THP 剂量为 40 ~ 50 mg/m^2。

（4）环磷酰胺：100 mg/m^2，口服，第 1 ~ 14 日；甲氨蝶呤：40 mg/m^2，静脉注射，第 1、8 日；氟尿嘧啶：600 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；28 日为 1 个周期。

（5）多西他赛：75 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；卡培他滨：1 250 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日；21 日为 1 个周期。

（6）紫杉醇：175 mg/m^2，静脉滴注 3 小时，第 1 日；吉西他滨：1 000 ~ 1 250 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日（第 1 日用于紫杉醇之后）；21 日为 1 个周期。

（7）曲妥珠单抗：4 mg/kg，静脉滴注 1.5 小时，第 1 日，之后 2 mg/kg，静脉滴注 0.5 小时，一周 1 次；或 8 mg/kg，静脉滴注 1.5 小时，第 1 日，之后 6 mg/kg，静脉滴注 1.5 小时，每 3 周 1 次。

10.2.4 消化道肿瘤

10.2.4.1 胃癌

（1）辅助化疗常用方案

①卡培他滨单药方案

卡培他滨：850 ~ 1 250 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日；3 周重复 1 次，共 8 个周期。

②卡培他滨联合顺铂（XP）方案

卡培他滨：1 000 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，间歇 7 日；顺铂：60 ~ 80 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；或一日 20 mg/m^2，静脉滴注，第 1 ~ 5 日；3 周重复 1 次，共 6 ~ 8 个周期。

③氟尿嘧啶联合顺铂（FP）方案

氟尿嘧啶：一日 425 ~ 750 mg/m^2，静脉滴注 24 h，第 1 ~ 5 日；顺铂：60 ~ 80 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日（或分 2 ~ 3 日用）；或一日 15 ~ 20 mg/m^2，静脉滴注，第 1 ~ 5 日；3 周重复 1 次，共 6 ~ 8 个周期。

④卡培他滨联合奥沙利铂（XELOX/CapeOX）

卡培他滨：850 ~ 1 000 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，间歇 7 日；奥沙利铂：130 mg/m^2，第 1 日，或 65 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；3 周重复 1 次，共 6 ~ 8 个周期。

⑤简化氟尿嘧啶／亚叶酸钙方案（s 亚叶酸钙 5FU2）

亚叶酸钙：200 ~ 400 mg/m^2，静脉滴注 2 小时，第 1、2 日；氟尿嘧啶：一日 400 mg/m^2，静脉注射，然后再用一日 600 mg/m^2，持续静脉滴注 22 小时，第 1、2 日；2 周重复 1 次，共 8 ~ 12 个周期。

⑥S-1/顺铂方案 S-1 B.S $\leqslant$ 1.25 m^2 40 mg，口服，一日 2 次；1.25 < B.S < 1.5 m^2，50 mg，口服，一日 2 次；B.S $\geqslant$ 1.5 m^2，60 mg，口服，一日 2 次；顺铂：

60 ~ 70 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；3 周重复 1 次。

⑦奥沙利铂 - 亚叶酸钙 - 氟尿嘧啶方案（FOLFOX4）

奥沙利铂：85 mg/m^2，静脉滴注 2 小时，第 1 日；亚叶酸钙：一日 200 mg/m^2，在氟尿嘧啶前 2 小时静脉滴注，第 1、2 日；氟尿嘧啶：一日 400 mg/m^2，静脉注射，然后再用一日 600 mg/m^2，持续静脉滴注 22 小时，第 1、2 日；2 周重复 1 次，共 8 ~ 12 个周期。

⑧奥沙利铂 - 亚叶酸钙 - 氟尿嘧啶（mFOLFOX6）

奥沙利铂：85 ~ 100 mg/m^2，静脉滴注 2 小时，第 1 日；亚叶酸钙：一日 400 mg/m^2，在氟尿嘧啶前 2 小时静脉滴注，第 1 日；氟尿嘧啶：一日 400 mg/m^2，静脉注射，然后再用一日 2 400 mg/m^2，持续静脉滴注 44 ~ 48 小时；2 周重复 1 次，共 8 ~ 12 个周期。

⑨奥沙利铂 - 亚叶酸钙 - 氟尿嘧啶方案（mFOLFOX7）

奥沙利铂：85 ~ 100 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；亚叶酸钙：一日 200 ~ 400 mg/m^2，在氟尿嘧啶前 2 小时静脉滴注，第 1、2 日；氟尿嘧啶：2 400 ~ 3 000 mg/m^2，持续静脉滴注 46 小时；2 周重复 1 次，共 8 ~ 12 个周期。

⑩表柔比星 - 顺铂 - 氟尿嘧啶方案（mECF 方案）

表柔比星：50 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；顺铂：60 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；氟尿嘧啶：一日 200 mg/m^2，持续静脉滴注，一日 1 次，或 500 ~ 600 mg/m^2，静脉滴注 24 h，第 1 ~ 5 日；3 周重复一次，共 6 ~ 8 个周期。

⑪卡培他滨 - 表柔比星 - 顺铂方案（ECX）

卡培他滨：一次 625 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，间歇 7 日；表柔比星：50 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；顺铂：60 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；3 周重复 1 次，共 6 ~ 8 个周期。

⑫卡培他滨 - 表柔比星 - 奥沙利铂方案（EOX）

卡培他滨：一次 625 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，间歇 7 日；表柔比星：50 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；奥沙利铂：130 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；3 周重复 1 次，共 6 ~ 8 个周期。

（2）新辅助化疗：应遵循高效低毒的原则，可考虑的化疗方案包括 ECF，或其衍生方案 ECX、EOX、EOF，或试用氟尿嘧啶类药物（包括卡培他滨）联合顺铂或奥沙利铂，联合紫杉烷类如 FOLFOX/XELOX/XELOPAC 等。术前化疗周期数为 2 ~ 4 个周期。

（3）术后联合放疗的化疗方案

①氟尿嘧啶一日 425 ~ 600 mg/m^2 加亚叶酸钙一日 20 mg/m^2，静脉滴注，第 1 ~ 5 日，一周重复 1 次。

②卡培他滨一次 625 mg/m^2，口服，一日 2 次，放疗期间每周第 1 ~ 5 日。

（4）复发转移性胃癌的姑息化疗：化疗方案除见所有术后辅助化疗方案外，其他方案如下。

①卡培他滨 - 多西他赛（TX）

卡培他滨：825 ~ 1 000 mg/m^2 口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，间歇 7 日；多西他赛：60 ~ 75 mg/m^2 静脉滴注，第 1 日；或 30 ~ 36 mg/m^2，静脉滴注，第 1、8 日；3 周重复 1 次。

注意事项：用药前应给予减轻水肿及预防过敏、止吐等药物。

②卡培他滨 - 紫杉醇（XELOPAC）

卡培他滨：825 ~ 1 000 mg/m^2，口服，一日 2 次，第 1 ~ 14 日，间歇 7 日；紫杉醇：135 ~ 175 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；3 周重复 1 次。

注意事项：用药前给予抗过敏药。

③多西他赛 - 顺铂（DC）或氟尿嘧啶（DF）

多西他赛：60 ~ 75 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；顺铂：60 ~ 75 mg/m^2，静脉滴注，第 1 日；或氟尿嘧啶：一日 500 ~ 750 mg/m^2，静脉滴注，第 1 ~ 5 日；3 周重复 1 次。

注意事项：用药前给予抗过敏药、止吐药，并注意充分水化，防止肾损害（用顺铂时）。

④多西他赛 - 顺铂 - 氟尿嘧啶（DCF）

多西他赛：60 mg/m^2，静脉滴注 3

小时，第1日；顺铂：60 mg/m²，静脉滴注，第1日；氟尿嘧啶：一日500～750 mg/m²，静脉滴注，第1～5日；3周重复1次。

注意事项：用药前应给予抗过敏药，注意药物对骨髓抑制作用。

⑤紫杉醇-顺铂-氟尿嘧啶（TCF）

紫杉醇：135～175 mg/m²，静脉滴注3小时，第1日；顺铂：60 mg/m²，静脉滴注，第1日；氟尿嘧啶：一日500～750 mg/m²，静脉滴注，第1～5日；3周重复1次。

注意事项：用药前应给予抗过敏药、止吐药物，并注意充分水化，防止肾损害。

⑥紫杉醇-顺铂-卡培他滨（TCX）

卡培他滨：825～1 000 mg/m²，口服，一日2次，第1～14日，间歇7日；紫杉醇：135～175 mg/m²，静脉滴注3小时，第1日；顺铂：60 mg/m²，静脉滴注，第1日；3周重复1次。

注意事项：用药前给予抗过敏药、止吐药物，并注意充分水化，防止肾损害。

⑦紫杉醇-顺铂（TC）或氟尿嘧啶（TF）

紫杉醇：125～175 mg/m²，静脉滴注，第1日；顺铂：60～75 mg/m²，静脉滴注，第1日；或氟尿嘧啶：一日500～750 mg/m²，静脉滴注，第1～5日；3周重复1次。

注意事项：用药前给予抗过敏药、止吐药物，并注意充分水化，防止肾损害（用顺铂时）。

⑧伊立替康-亚叶酸钙-氟尿嘧啶（FOLFIRI）

伊立替康：150～180 mg/m²，静脉滴注30～120分钟，第1日；亚叶酸钙：200～400 mg/m²，在氟尿嘧啶之前，静脉输注，第1、2日；氟尿嘧啶：一次400 mg/m²，静脉注射，然后600 mg/m²持续静脉滴注22小时，第1、2日；2周重复1次。

注意事项：注意观察迟发型腹泻和急性胆碱能样反应。

⑨伊立替康+顺铂（IP）

伊立替康：150～180 mg/m²，静脉滴注0.5～2小时，第1日；顺铂：60 mg/m²，静脉滴注，第1日；3～4周重复1次。

注意事项：注意观察迟发型腹泻和急性胆碱能样反应，注意药物对骨髓抑制的作用。

⑩替加氟/尿嘧啶-顺铂（UFT）方案

替加氟/尿嘧啶（每片50 mg/112 mg）：一次3片，一日3次，第1～21日；顺铂：60～75 mg/m²静脉滴注，第1日；3周重复1次。

10.2.4.2 大肠癌

（1）辅助化疗

① FOLFOX4方案见前述，术后6个月内进行8～12个周期。

②亚叶酸钙5FU2方案见前述，用于高危Ⅱ期患者，术后6个月内进行8～12个周期。

③卡培他滨单药，方案见前述，可用于高危Ⅱ期或Ⅲ期患者难以耐受联合化疗者，术后6个月内进行8个周期。

（2）新辅助化疗：参照姑息化疗的方案，术前进行3～4个周期。

（3）姑息化疗（每3个周期进行评效一次）

① FOLFOX4、(m) FOLFOX6、(m) FOLFOX7，方案见前述。

② XELOX方案见前述。

③ FOLFIRI方案见前述。

④卡培他滨单药方案见前述。

⑤亚叶酸钙-氟尿嘧啶方案见前述。

⑥联合贝伐单抗：与①～⑤各方案联合，贝伐单抗5 mg/kg，2周重复1次。

⑦联合西妥昔单抗：与①～⑤各方案联合，西妥昔单抗，首剂一周400 mg/m²，维持剂量一周250 mg/m²。

10.2.4.3 食管癌

(1)辅助化疗(术后进行2～4个周期)

紫杉醇-顺铂（TP）方案

紫杉醇：150～175 mg/m²，静脉滴注，第1日；顺铂：75 mg/m²，静脉滴注，第1日；3周重复1次。

（2）姑息化疗（每3个周期进行评效一次）

①伊立替康＋顺铂（TP）方案，见前述。

②长春瑞滨－顺铂方案（NP方案）

长春瑞滨：25 mg/m²，静脉滴注，第1日、8日；顺铂：75 mg/m²，静脉滴注，第1日；3周重复1次。

③顺铂－氟尿嘧啶方案（FP方案）

顺铂：60～80 mg/m²，静脉滴注，第1日；氟尿嘧啶：750 mg/m²，静脉滴注，第1～5日。

④顺铂－依托泊苷方案（PE方案）

顺铂：60～80 mg/m²，静脉滴注，第1日；依托泊苷：100 mg/m²，静脉滴注，第1～3日；3周重复1次。

⑤顺铂－氟尿嘧啶－平阳霉素方案

顺铂：60～80 mg/m²，静脉滴注，第1日；氟尿嘧啶：500 mg/m²，静脉滴注，第1～3日；平阳霉素：6 mg/m²，肌内、静脉注射或静脉滴注，第1日；3周重复1次。

⑥顺铂＋吉西他滨＋氟尿嘧啶方案

顺铂：75 mg/m²，静脉滴注第1日；

吉西他滨：1 000 mg/m²，静脉滴注第1日、8日；

氟尿嘧啶：600 mg/m²，持续静脉滴注24小时，第1日、2日、3日、4日、5日；3周重复1次。

10.2.4.4 胰腺癌

姑息化疗（每2～3个周期进行评价疗效）。

（1）吉西他滨单药

吉西他滨：一次1 000 mg/m²，一周1次，静脉滴注，联用7周后间歇1周，然后3周间歇1周。

（2）吉西他滨－奥沙利铂（GEMOX）

吉西他滨：1 000 mg/m²，静脉滴注，第1日、8日；奥沙利铂：130 mg/m²，静脉滴注，第1日给予。

（3）吉西他滨－卡培他滨（GEM+xeloda）

吉西他滨：1 000 mg/m²，静脉滴注，第1日、8日；卡培他滨：825～1 000 mg/m²，口服，一日2次，第1～14日，间歇7日。

（4）吉西他滨－氟尿嘧啶

吉西他滨：1 000 mg/m²，静脉滴注，第1日、8日；氟尿嘧啶：750 mg/m²，静脉滴注，第1～5日。

（5）吉西他滨－顺铂

吉西他滨：1 000 mg/m²，静脉滴注，第1日、8日；顺铂：60～80 mg/m²，静脉滴注，第1日给予。

10.3 抗肿瘤药

10.3.1 细胞毒类药

细胞毒类抗肿瘤药主要包括以下6类，即作用于DNA化学结构的药物、影响核酸生物合成的药物、作用于核酸转录的药物、拓扑异构酶抑制药、干扰微管蛋白合成的药物及其他细胞毒药物等。它包括传统分类中的细胞周期特异性和非特异性药物，因其共同特点是通过作用于细胞的DNA、RNA和蛋白质的合成、复制或转录过程导致细胞死亡而被归为细胞毒类药物。由于这类药物的作用靶部位为增殖活跃的细胞，因此对生长旺盛、自我更新迅速的正常组织和器官都可能产生明显的不良反应，如导致骨髓抑制和消化系统反应，妊娠或哺乳期妇女应该禁用所有细胞毒类药物。

10.3.1.1 作用于DNA化学结构的药物

主要包括烷化剂、铂类化合物及蒽环类药物等。由于这类药物的作用靶为细胞DNA，因此对多种生长活跃的正常组织和重要器官都将产生明显毒性，常见不良反应包括骨髓抑制、消化道反应、心脏毒性、皮肤黏膜毒性、脱发、神经毒性、肺毒性及肝肾功能损伤等。在临床应用过程中，应该权衡利弊、合理选择，必要时根据药物毒性情况，酌情减低药物剂量甚至停药。

（1）烷化剂：烷化剂是最早问世的细胞毒药物，氮芥（HN2）是最早应用的烷化剂，主要用于恶性淋巴瘤和慢性淋巴细胞白血病；也可用于恶性肿瘤特别是小细胞肺癌所致的上腔静脉综合征。环磷酰胺（CTX）抗瘤谱较广，对恶性淋巴瘤疗效显著；塞替派（TSPA）局部刺激小，可选取多种给药方式。卡莫司汀（BCNU）

脂溶性大，能透过血脑屏障进入脑组织，可用于原发性脑瘤、脑转移瘤、脑膜白血病等；烷化剂几乎具有细胞毒类药物所有典型的不良反应，骨髓抑制为该类药物最为常见的不良反应，为剂量限制性毒性。在药物特异性不良反应中，HN2、CTX、BCNU 可出现中度恶心呕吐；CTX 可出现出血性膀胱炎，尤其在大剂量给药和既往接受盆腔放疗的患者易发生，可预防性给予美司钠；BCNU 所致骨髓毒性发生较迟。近年来研究显示，提高烷化剂类药物剂量强度，能明显增加疗效，但大剂量应用时应严密监测其不良反应，尤其是非血液学毒性如出血性膀胱炎、心肌炎、肺纤维化及中毒性肝炎。

氮芥[保(甲)]

Chlormethine

【适应证】霍奇金病、恶性淋巴瘤与肺癌，用于腔内注射控制癌性胸腔积液。

【注意事项】(1) 本品剂量限制性毒性为骨髓抑制，故应密切观察血象变化，每周查血象 1 ~ 2 次。(2) 剂量按体重超过 0.6 mg/kg 可导致中枢神经系统毒性、严重骨髓抑制及心脏毒性。必须在有经验的专科医师指导下用药。(3) 在用药期间，应定期检查肝肾功能，测定血清尿酸水平。(4) 长期应用氮芥，继发性肿瘤发生的危险性增加。(5) 本品可使血及尿酸水平增加，血浆胆碱酯酶浓度减少。(6) 有严重呕吐患者应该测定血浆氯化物、血钠、血钾和血钙水平。(7) 静脉给药由近针端输液皮管中冲入；体腔内注射时用 0.9%氯化钠注射液 20 ~ 40 ml 稀释，在抽液后即时注入。(8) 极少用于腹腔内，因可能引起严重疼痛、肠梗阻。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠及哺乳期妇女、骨髓抑制、感染、肿瘤细胞浸润骨髓、曾接受过化疗或放射治疗者。

【不良反应】(1) 血压系统：本品对骨髓抑制可引起显著的白细胞计数及血小板减少、严重者能使全血细胞减少；白细胞计数下降最低值一般在注射后第 7 ~ 15 日，停药后 2 ~ 4 周多可恢复。(2) 消化系统：恶心、呕吐等反应常出现于注射后 3 ~ 6 小时后，可持续 24 小时，使用本品前宜加用镇静止吐药。(3) 局部反应：对局部组织的刺激较强，多次注射可引起血管硬化、疼痛及血栓性静脉炎，如药液外溢可致局部组织坏死；高浓度局部灌注，可致严重的外周静脉炎、肌肉坏死及脱皮。局部应用也常产生迟发性皮肤过敏反应。(4) 生殖系统：可见月经不调、卵巢功能衰竭、睾丸萎缩、精子减少等。(5) 中枢神经系统：剂量按体重超过 0.6 mg/kg 可致中枢神经系统毒性，高剂量也可引起低钙血症及心脏损伤；少见头晕、乏力及脱发等。霍奇金病患者应用含有氮芥的 MOPP 方案，在 2 ~ 3 年后急性非淋巴细胞性白血病及非霍奇金性淋巴瘤发病率明显增加。

【用法与用量】(1) 静脉给药：一次 5 ~ 10 mg (0.1 ~ 0.2 mg/kg)，一周 1 ~ 2 次，1 个疗程总量为 30 ~ 60 mg；因有蓄积毒性，故疗程间歇不宜少于 2 ~ 4 周。(2) 腔内注射：一次 10 ~ 20 mg (0.2 ~ 0.4 mg/kg)，溶于 20 ~ 40 ml 氯化钠注射液中，尽量抽去腔内积液后注入，注射后 5 分钟内应多次变换体位，以使药液在腔内分布均匀，5 ~ 7 日 1 次，4 ~ 5 次为 1 个疗程。(3) 动脉给药：一次 5 ~ 10 mg (0.1 ~ 0.2 mg/kg)，以氯化钠注射液稀释，一日或隔日 1 次，总量可较静脉给药量稍高。(4) 创面冲洗：一次 5 ~ 10 mg 稀释后冲洗手术创面。

【制剂与规格】盐酸氮芥注射液：① 1 ml : 5 mg；② 2 ml : 10 mg。

环磷酰胺[保(甲)]

Cyclophosphamide

【适应证】用于恶性淋巴瘤、急性或慢性淋巴细胞白血病、多发性骨髓瘤、乳腺癌、睾丸肿瘤、卵巢癌、肺癌、头颈部鳞癌、鼻咽癌、神经母细胞瘤、横纹肌肉瘤及骨肉瘤。

【注意事项】(1) 应用本品时应鼓励患者多饮水，大剂量应用时应水化、利尿，同时给予尿路保护药美司钠。(2) 当大剂量用药时，除应密切观察骨髓功能外，尤其要注意非血液学毒性如心肌炎、中毒性肝炎及肺纤维化等。(3) 当肝肾功能损害、骨髓转移或既往曾接受多程化放疗时，环

磷酰胺的剂量应减少至治疗量的 1/3 ~ 1/2。(4) 由于本品需在肝内活化，因此腔内给药无直接作用。(5) 环磷酰胺水溶液仅能稳定 2 ~ 3 小时，最好现配现用。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠及哺乳期妇女、骨髓抑制、感染、肝肾功能损害者。

【不良反应】常见白细胞计数减少、用药后 1 ~ 2 周最低值，2 ~ 3 周可恢复；食欲减退、恶心、呕吐，停药 1 ~ 3 日可恢复；大剂量使用，缺乏有效预防措施，可致出血性膀胱炎；表现少尿、血尿、蛋白尿、其代谢产物丙烯醛刺激膀胱所致；脱发、口腔炎、中毒性肝炎、皮肤色素沉着、肺纤维化、月经紊乱、无精或少精、不育症。

【用法与用量】(1) 成人：单药静脉给药按体表面积一次 500 ~ 1 000 mg/m^2，加 0.9%氯化钠注射液 20 ~ 30 ml，静脉给药，一周 1 次，连用 2 次，休息 1 ~ 2 周重复。联合用药 500 ~ 600 mg/m^2。(2) 儿童：静脉给药，一次 10 ~ 15 mg/kg，加 0.9%氯化钠注射液 20 ml 稀释后缓慢注射，一周 1 次，连用 2 次，休息 1 ~ 2 周重复。也可肌内注射。

【制剂与规格】注射用环磷酰胺：① 100 mg；② 200 mg；③ 500 mg。

异环磷酰胺 [保（乙）]

Ifosfamide

【适应证】用于肺癌、卵巢癌、睾丸肿瘤、软组织肉瘤、乳腺癌、肾上腺癌、子宫内膜癌及恶性淋巴瘤。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如低白蛋白血症、肝肾功能不全、骨髓抑制及育龄期妇女。(2) 本品的代谢物对尿路有刺激性，应用时应鼓励患者多饮水，大剂量应用时应水化、利尿，同时给予美司钠。(3) 在用药期间，应定期监测白细胞计数、血小板计数和肝肾功能。(4) 本品水溶液不稳定，须现配现用。(5) 糖尿病患者测血糖并调整糖尿病药物剂量。(6) 发热或白细胞计数减少的患者给予抗生素或抗真菌药治疗，加强口腔卫生。

【禁忌证】对本品过敏者，肾功能不全及或输尿管阻塞、膀胱炎、妊娠及哺乳期妇女、骨髓抑制、细菌感染者。

【不良反应】(1) 血液系统：本品可抑制骨髓造血功能，常见白细胞计数减少、较血小板减少常见，最低值在用药后 1 ~ 2 周，多在 2 ~ 3 周后恢复，对肝功能有影响。(2) 消化系统：可见食欲减退、恶心、呕吐，一般停药 1 ~ 3 日即可消失。(3) 泌尿系统：可致出血性膀胱炎，表现为排尿困难、尿频和尿痛；可在给药后几小时或几周内出现，通常在停药后几日内消失。若给保护药美司钠，分次给药和适当水化，可减少此不良反应发生率。出现急性输尿管坏死少见。(4) 中枢神经系统：与剂量有关，表现为焦虑不安、神情慌乱、幻觉和乏力等；少见晕厥、癫痫样发作，甚至昏迷；可能会影响患者驾车和操作机器能力。少见的有一过性无症状肝肾功能异常；若高剂量用药可因肾毒性产生代谢性酸中毒。(5) 循环系统：罕见心脏和肺毒性。(6) 免疫与生殖系统：长期用药可产生免疫抑制、垂体功能低下、不育症和继发性肿瘤。(7) 其他：包括脱发，注射部位可出现静脉炎等。

【用法与用量】(1) 单药治疗：一日 1.2 ~ 2.4 g/m^2，静脉滴注 30 ~ 120 分钟，连续 5 日为 1 个疗程。(2) 联合用药：一日 1.2～2.0 g/m^2，静脉滴注，连续 5 日为 1 个疗程。每 1 个疗程间隔 3 ~ 4 周。(3) 给异环磷酰胺的同时及其后第 4、8、12 小时各静脉注射美司钠 1 次。一次剂量为本品的 20%，并需补充液体。

【制剂与规格】注射用异环磷酰胺：① 0.5 g；② 1.0 g。

苯丁酸氮芥 [保（乙）]

Chlorambucil

【适应证】用于慢性淋巴细胞白血病、恶性淋巴瘤、多发性骨髓瘤、巨球蛋白血症、卵巢癌。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如痛风病史、泌尿系统结石者。(2) 在用药期间，应定期检查白细胞计数及分类，血小板计数，定期做肾功能检查（尿素氮、肌酐清除率），定期检查肝功能（血清胆红素及 AST）和测定血清尿酸水平。(3) 与其他骨髓抑制药物同时应用可增加疗效，但剂量必须适当调整。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠及哺乳期妇女，严重骨髓抑制，感染者。

【不良反应】胃肠道反应较轻，较大剂量也可出现恶心、呕吐；长期服用本品可产生免疫抑制与骨髓抑制；少见肝毒性、皮炎；长期服用本品，在白血病患者中易产生继发性肿瘤；青春期病例长期应用可产生精子缺乏或持久不育；长期或高剂量应用可致间质性肺炎。

【用法与用量】口服。成人一日按体重 0.2 mg/kg，每 3 ~ 4 周连服 10 ~ 14 日（可一次或分次给药）。儿童一日按体重 0.1 ~ 0.2 mg/kg。

【制剂与规格】苯丁酸氮芥片：2 mg。

苯丁酸氮芥纸型片：每格 2 mg。

塞替派[保（甲）]

Thiotepa

【适应证】用于乳腺癌、卵巢癌、癌性体腔积液的腔内注射、膀胱癌的局部灌注、胃肠道肿瘤。

【注意事项】（1）肝肾功能较差时，本品应用较低的剂量。（2）妊娠初期的 3 个月应避免使用此药，因其有致突变或致畸胎作用，可增加胎儿死亡及先天性畸形。（3）下列情况慎用或减量使用，如骨髓抑制、肝功能损害、感染、肾功能损害、肿瘤细胞浸润骨髓、有泌尿系统结石或痛风病史。（4）在用药期间，每周都要定期检查外周血象，白细胞计数与血小板及肝肾功能。停药后 3 周内应继续进行相应检查，以防止出现持续的严重骨髓抑制。（5）在白血病、淋巴瘤患者中为防止尿酸性肾病或高尿酸血症，可给予大量补液或别嘌醇。（6）尽量减少与其他烷化剂联合使用，或同时接受放射治疗。

【禁忌证】对本品过敏者，有严重肝肾功能损害者，妊娠及哺乳期妇女，有严重骨髓抑制者。

【不良反应】骨髓抑制是最常见的剂量限制毒性，多在用药后 1 ~ 6 周发生，停药后大多可恢复；有些病例在疗程结束时开始下降，少数病例抑制时间较长。另常见食欲减退、恶心、呕吐和腹泻等；少见过敏反应；偶见发热、皮疹、出血性膀胱炎、头痛、头晕、闭经及影响精子形成。此外，局部可见注射部位疼痛。

【用法与用量】（1）静脉或肌内注射（单一用药）：一次 10 mg（0.2 mg/kg），一日 1 次，连续 5 日后改为一周 3 次，1 个疗程总量 300 mg，如血象良好，在第 1 个疗程结束后 1.5 ~ 2 个月后可重复疗程。（2）胸腹腔或心包腔内注射：一次 10 ~ 30 mg，每周 1 ~ 2 次。（3）膀胱腔内灌注：一次排空尿液后将导尿管插入膀胱腔内注入 50 ~ 100 mg（溶于 50 ~ 100 ml 氯化钠注射液中），一周 1 ~ 2 次，10 次为 1 个疗程。（4）动脉注射：一次 10 ~ 20 mg，用法同静脉注射。（5）瘤内注射：开始按体重 0.6 ~ 0.8 mg/kg 向瘤体内直接注射，以后维持治疗根据患者情况按体重 0.07 ~ 0.8 mg/kg 注射，1 ~ 4 周重复 1 次。（6）儿童用量：肌内注射或静脉注射，根据体重一次 0.2 ~ 0.3 mg/kg，一日 1 次，连用 5 次后改为一周 1 次，25 ~ 40 mg 为 1 个疗程。

【制剂与规格】注射用塞替派：10 mg。

塞替派注射液：1 ml ∶ 10 mg。

白消安[保（甲/乙）]

Busulfan

【适应证】用于慢性粒细胞白血病的慢性期，亦可用于治疗原发性血小板增多症、真性红细胞增多症等慢性骨髓增殖性疾病。

【注意事项】（1）于开始治疗前及疗程中要每周 1 ~ 2 次定期密切随访血象与肝肾功能的动态变化，以便及时调整药物剂量。应定期检查肾功能（血尿素氮、肌酐清除率）、肝功能（血清胆红素、ALT）及测定血清尿酸量。（2）下列情况慎用，如骨髓有抑制现象、痛风病史、感染、尿酸性肾结石病史、以往曾接受过细胞毒药物或放射治疗者。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见粒细胞缺乏、血小板减少、长期用药可产生骨髓抑制、并发药物性再生障碍性贫血、严重者需及时停药；另可见肺纤维化、皮肤色素沉着、高尿酸血症、性功能减退、男性乳房女性化、睾丸萎缩、女性月经不调等；罕见白内障、多形红斑皮疹、结节性多动脉炎。

【用法与用量】口服：①成人。用于慢性粒细胞白血病，一日总量按体表面积为4～6 mg/m²，直至白细胞计数下降至15×10⁹/L以下停药。如服药3周，白细胞计数仍不见下降，可适当增加剂量。对缓解期短于3个月的患者，可给维持量每周2次，一次2 mg以维持白细胞计数在10×10⁹/L左右。真性红细胞增多症，一日4～6 mg，分次口服，以后根据血象、病情及疗效调整剂量。②儿童。诱导剂量为一日按体重0.06～0.12 mg/kg或按体表面积一日1.8～3.6 mg/m²。以后根据血象、病情及疗效调整剂量，以维持白细胞计数在20×10⁹/L以上。

【制剂与规格】白消安片：① 0.5 mg；② 2 mg。

六甲蜜胺[保(乙)]

Altretamine

【适应证】用于卵巢癌、小细胞肺癌、恶性淋巴瘤、子宫内膜癌的联合化疗。

【注意事项】(1) 在用药期间，应定期查血象及肝功能。(2) 本品有刺激性，避免与皮肤和黏膜直接接触。(3) ＞65岁老年患者应减量。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠及哺乳期妇女，严重骨髓抑制和神经毒性患者。

【不良反应】严重的恶心、呕吐为剂量限制性毒性，骨髓抑制轻至中度，以白细胞计数降低为著，多发生于治疗1周后，3～4周达最低点；神经毒性出现于长期服用后，为剂量限制性毒性，4～5个月可减轻或消失；偶见脱发、膀胱炎、皮疹、瘙痒、体重减轻等。

【用法与用量】口服：按体重一日10～16 mg/kg，分4次服用，21日为1个疗程或一日6～8 mg/kg，90日为1个疗程。联合方案中，推荐总量为150～200 mg/m²，连用14日，耐受性好。餐后1～1.5小时或睡前服用能减少胃肠道反应。

【制剂与规格】六甲蜜胺片：①50 mg；② 100 mg。

六甲蜜胺胶囊：① 50 mg；② 100 mg。

美法仑[保(乙)]

Melphalan

【适应证】用于多发性骨髓瘤，晚期卵巢腺癌，晚期乳腺癌、真性红细胞增多症。

【注意事项】(1) 长期应用增加致癌风险。(2) 对性腺功能有抑制作用。(3) 密切观察肾功能不全的骨髓瘤患者可能发生的尿毒症骨髓抑制。(4) 对近期接受过放疗和化疗的患者应注意骨髓毒性。(5) 可引起血及尿尿酸增加及羟基吲哚醋酸增加，干扰诊断。(6) 有痛风史、泌尿道结石者慎用。(7) 定期检查白细胞计数、血小板、血尿素氮、血肌酐、血尿酸。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见骨髓抑制、白细胞计数降低、血小板降低、溶血性贫血、恶心、呕吐、食欲减退、胃炎、腹泻、肝功能异常、肝炎、黄疸、复发性脉管炎、间质性肺炎、肺纤维化、荨麻疹、水肿、皮疹、过敏性休克，斑丘疹、瘙痒、脱发及黏膜炎。

【用法与用量】口服：①用于多发性骨髓瘤，成人一日0.15 mg/kg，分次服用，连续4日，6周后重复疗程。②用于卵巢腺癌，一日0.2 mg/kg，连续5日，4～8周重复疗程。③用于晚期乳腺癌，一日0.15 mg/kg或一日6 mg/m²，连续5日，6周后重复疗程。④用于真性红细胞增多症，诱导缓解期，一日6～10 mg，共5～7日，之后可一日2～4 mg，直至控制症状。维持剂量，一次2～6 mg，一周1次。

【制剂与规格】美法仑片：2 mg。

氮甲[保(乙)]

N-Formylmerphalan

【适应证】本品对睾丸精原细胞瘤的疗效最好，对多发性骨髓瘤、恶性淋巴瘤也有效。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如骨髓抑制、严重感染、肿瘤细胞浸润骨髓、以前曾接受过化疗或放射治疗等。(2) 在用药期间，应定期检查白细胞计数及分类，测定血清尿酸水平。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、乏力、头晕及脱发；对骨髓的抑制也较其他细胞毒素药轻和缓和；白细胞计数下降多在治疗开始后 2 ~ 3 周出现，在停药后 2 ~ 4 周即可恢复，此药对血小板的影响比白细胞计数为轻；对肝肾功能则无明显的影响。

【用法与用量】口服：①成人。一日按体重 3 ~ 4 mg/kg，加碳酸氢钠 1 g 同服，睡前 1 次或分 3 次服用。②儿童。一日按体重 3 ~ 4 mg/kg，睡前一次或分 3 次。80 ~ 160 mg 为 1 个疗程。

【制剂与规格】氮甲片：50 mg。

卡莫司汀[保(乙)]

Carmustine (BCNU)

【适应证】用于脑瘤（恶性胶质细胞瘤、脑干胶质瘤、成神经管细胞瘤、星形胶质细胞瘤、室管膜瘤）、脑转移瘤、脑膜白血病、恶性淋巴瘤、多发性骨髓瘤，与其他药物合用对恶性黑色素瘤有效。

【注意事项】(1) 老年人易有肾功能减退，可影响排泄，应慎用。(2) 下列情况慎用，如骨髓抑制、感染、肝肾功能异常、接受过放射治疗或抗癌药治疗的患者。(3) 对诊断的干扰：本品可引起肝肾功能异常。(4)在用药期间,应注意检查血常规、血小板、肝肾功能、肺功能。(5) 本品可抑制身体免疫机制，使疫苗接种不能激发身体抗体产生。化疗结束后 3 个月内不宜接种活疫苗。(6) 预防感染，注意口腔卫生。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：一次静脉注射后，骨髓抑制常发生在用药后 4 ~ 6 周，白细胞计数最低值见于 5 ~ 6 周，在 6 ~ 7 周逐渐恢复；但多次用药，可延迟至 10 ~ 12 周恢复；一次静脉注射后，血小板最低值见于 4 ~ 5 周，在 6 ~ 7 周恢复，血小板下降常比白细胞计数严重；静脉注射部位可产生血栓性静脉炎，大剂量可产生脑脊髓病，长期作用可产生间质性肺炎或肺纤维化；有时甚至 1 ~ 2 个疗程后即出现肺并发症，部分患者不能恢复。(2) 消化系统：可见恶心、呕吐，用药后 2 小时即可出现，常持续 4 ~ 6 小时；另对肝肾均有影响，肝脏损害常可恢复，肾脏毒性可见氮质血症、功能减退、肾脏缩小。(3) 生殖系统：可致畸胎，可抑制睾丸或卵子功能，引起闭经或精子缺乏。

【用法与用量】静脉滴注：按体表面积 100 mg/m^2，一日 1 次，连用 2 ~ 3 日；或 200 mg/m^2，用 1 次，每 6 ~ 8 周重复。溶入 5% 葡萄糖或 0.9%氯化钠注射液 150 ml 中快速静脉滴注。

【制剂与规格】卡莫司汀注射液：2 g ∶ 125 mg。

司莫司汀[保(甲)]

Semustine

【适应证】用于脑部原发肿瘤（如成胶质细胞瘤）及继发肿瘤；与氟尿嘧啶合用治疗胃癌及直肠癌；治疗霍奇金病。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如骨髓抑制、感染、肝肾功能不全、有白细胞计数低下史，有溃疡病或食管静脉曲张者。(2) 在用药期间，应注意随访检查血常规及血小板、血尿素氮、血尿酸、肌酐清除率、血胆红素、ALT 及 AST 等。(3) 本品可引起肝功能一过性异常。(4) 合并感染时应先治疗感染。

【禁忌证】严重骨髓造血功能抑制者、肝肾功能不全者、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 消化系统：可见恶心、呕吐，肝脏与肾脏均可因与较高浓度的药物接触，影响器官功能。(2) 血液系统：可见血小板减少、白细胞计数降低，由于本品对造血干细胞亦有抑制，可在服药后第 1 周及第 4 周先后出现 2 次，第 6 ~ 8 周才恢复正常，但骨髓抑制有累积性。(3) 生殖系统：有致畸可能，亦可抑制睾丸或卵巢功能，引起闭经或精子缺乏。(4) 其他：可见瘙痒、脱发、全身性皮疹。

【用法与用量】口服：成人和儿童均按体表面积一次 80 ~ 100 mg/m^2，间隔 6 ~ 8 周。

【制剂与规格】司莫司汀胶囊：① 10 mg；② 50 mg。

福莫司汀[保(乙)]

Fotemustine

【适应证】用于原发性恶性脑肿瘤和播散性恶性黑色素瘤（包括脑内部位）。

【注意事项】(1) 不推荐将本品用于过去4周内接受过化疗（或6周内用过亚硝基脲类药物治疗）的患者。(2) 只有患者在血小板和（或）粒细胞计数分别≥ 100×10^9/L 和 2.0×10^9/L 的情况才考虑使用本品。(3) 一次新给药前，均需进行血细胞计数，并根据血液学状态调整用药剂量。当血小板 > 100×10^9/L，粒细胞 N > 80×10^9/L 时，给药剂量为100%。当血小板 100×10^9/L ≥ N > 80×10^9/L，粒细胞 2×10^9/L ≥ N > 1.5×10^9/L 时，给药剂量为75%。当血小板 100×10^9/L ≥ N > 80×10^9/L，粒细胞 1.5×10^9/L ≥ N > 1.0×10^9/L 时，给药剂量为50%。当血小板 ≤ 80×10^9/L，粒细胞 N ≤ 1.0×10^9/L 时，推迟治疗。(4) 从诱导治疗开始到维持治疗开始之间，推荐的间隔期是8周，每两次维持治疗周期之间，间隔期是3周。(5) 只有在血小板和（或）粒性白细胞计数分别达到 100×10^9/L 和 2.0×10^9/L 时，才考虑进行维持治疗。(6) 在诱导及其后治疗期间进行肝功能检查。(7) 配制的溶液应避免接触皮肤和黏膜，以及任何药物溶液吸收的可能性，建议配制溶液时戴口罩和保护手套，如果意外溅出，用水彻底冲洗。(8) 污染的物品应在保证安全的条件下予以废弃。(9) 本品通常不推荐与减毒活疫苗联合使用。

【禁忌证】合并使用黄热病疫苗和采用苯妥英钠作为预防治疗，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见血小板、白细胞计数减少、发生时间较晚，最低水平分别在首剂诱导治疗后的4～5周和5～6周出现；若在注射用福莫司汀治疗前，进行过化学治疗和（或）本品与其他可以诱导造血毒性的药物联合应用时，会增加血液系统的不良反应。(2) 消化系统：可见恶心、呕吐、腹泻、腹痛、多出现在注射后2小时内，ALT及AST、尿素氮、碱性磷酸酶和血胆红素中有中度暂时性、可逆性的增高。(3) 中枢神经系统：可见发热、暂时性、可逆性的神经功能障碍（意识障碍、感觉异常、失味症）等。(4) 皮肤与软组织：可见瘙痒。(5) 其他：与达卡巴嗪联合应用时，可观察到有极少发生的肺毒性（急性成年人呼吸抑制综合征）。局部注射部位可见静脉炎。

【用法与用量】静脉输注：在使用前立即配制溶液。溶液一经配制，须在避光条件下给予；静脉输注控制在1小时以上。用安瓿瓶内的4 ml无菌乙醇溶液将福莫司汀瓶中的内容物溶解，然后计算好用药剂量，将溶液用250 ml 5%等渗葡萄糖注射液稀释后静脉输注。①单一药剂化疗包括诱导治疗，一周1次，连续3次后，停止用药4～5周。维持治疗，3周治疗1次。通常使用剂量100 mg/m²。②联合化疗，去掉诱导治疗中的第3次给药，剂量维持100 mg/m²。

【制剂与规格】注射用福莫司汀：208 mg。

尼莫司汀[保(乙)]

Nimustine

【适应证】用于脑肿瘤、胃癌、肝癌、结直肠癌、肺癌、恶性淋巴瘤及慢性白血病。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肝损坏患者、肾损坏患者、合并感染症患者、水痘患者。(2) 长期用药会加重不良反应，患者骨髓受损后易形成MDS症候群、急性白血病等，因此，应慎重给药。(3) 儿童因代谢系统尚未成熟，易出现不良反应（白细胞计数减少等），故低体重新生儿、新生儿、乳儿、幼儿及儿童给药时，应注意观察，慎重给药。儿童及育龄患者用药时，应考虑对性腺的影响。(4) 有时出现迟缓性骨髓功能抑制等严重不良反应，因此一次给药后至少6周应每周进行临床检验（血液检验、肝肾功能检查等），充分观察患者状态。若发现异常，应减量或停药。(5) 应充分注意感染症及出血倾向的出现或恶化。

【禁忌证】严重过敏史者，骨髓功能抑制者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见

骨髓抑制、白细胞计数减少、血小板减少、贫血、低蛋白血症，有时出现出血倾向等，因此一次给药后至少6周应每周进行周围血液检查，若发现异常应做适当处理。(2) 呼吸系统：偶见间质性肺炎及肺纤维化。(3) 消化系统：可见呕吐、食欲减退、恶心、欲吐、腹泻和口腔炎等；少见ALT及AST升高，偶见BUN升高、蛋白尿。(4) 皮肤：常见皮疹、脱发、过敏反应。(5) 中枢神经系统：可见发热、全身疲乏；少见头痛；偶见眩晕、痉挛等。

【用法与用量】按每5 mg溶于1 ml注射用蒸馏水的比例溶解，供静脉或动脉给药。(1) 以盐酸尼莫司汀计，一次给药2～3 mg/kg体重，其后据血象停药4～6周。(2) 以盐酸尼莫司汀计，一次给药2 mg/kg体重，隔1周给药1次，给药2～3周后，据血象停药4～6周。应随年龄及症状适当增减。(3) 给药途径：不得皮下给药或肌内注射。调制时，与其他药物配伍，可能会引起某些理化改变，故应注意。给药时，溶解后应尽快使用。静脉给药时，若药液漏于血管外，会引起注射部位硬结及坏死，故应慎重注射以免药液漏于血管外。

【制剂与规格】注射用盐酸尼莫司汀：25 mg。

洛莫司汀[保(乙)]

Lomustine

【适应证】用于脑部原发肿瘤（如成胶质细胞瘤）及继发肿瘤；与氟尿嘧啶合用治疗胃癌及直肠癌、与甲氨蝶呤、环磷酰胺合用治疗支气管肺癌；治疗霍奇金病。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如骨髓抑制、感染、肾功能不全、经过放射治疗或化疗的患者、或有白细胞计数低下、有溃疡病或食管静脉曲张者。(2) 在用药期间，应注意检查血象、血尿素氮、血尿酸、肌酐清除率、血胆红素、ALT及AST。(3) 本品可引起肝功能一过性异常。(4) 用药当日不能饮酒。(5) 有感染的患者应先治疗感染。(6) 本品有延迟骨髓抑制作用，两次给药间歇不宜短于6周。

【禁忌证】肝功能损害者，严重骨髓抑制者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】口服后6小时内可发生恶心、呕吐，预先应用镇静药或甲氧氯普胺并空腹服药可减轻；少见胃肠道出血及肝功能损害；服药后3～5周可见血小板减少、白细胞计数降低可在服药后第1及第4周先后出现两次，第6～8周才恢复，骨髓抑制有累积性，偶见全身性皮疹、有致畸胎的可能，亦可能抑制睾丸或卵巢功能，引起闭经或精子缺乏。

【用法与用量】口服：成人和儿童均按体表面积一次80～100 mg/m^2，间隔6～8周。

【制剂与规格】洛莫司汀胶囊：① 40 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

硝卡芥[保(乙)]

Nitrocaphane

【适应证】用于肺癌、恶性淋巴瘤、头颈部癌、子宫颈癌及癌性腔内积液。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如骨髓抑制、严重感染、肿瘤细胞浸润骨髓、以前曾接受过化疗或放疗，肝肾功能损伤者。(2) 在用药期间，应密切监测血常规和血小板。(3) 本品可能引起心肌损伤，应注意。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见恶心、呕吐、食欲减退、脱发、乏力、皮疹；多数患者有白细胞计数及血小板减少、少数患者较严重。

【用法与用量】(1) 静脉给药：一次20～40 mg，用氯化钠注射液溶解后缓慢注射，一日或隔日1次，总量为200～400 mg。(2) 动脉给药：剂量与静脉给药相同。(3) 腔内注射：一次40～60 mg，每周1～2次。(4) 外敷：用70%二甲基亚砜溶液将硝卡芥溶解为20～30 mg/ml，一日1～2次，做肿瘤局部外敷。(5) 瘤内注射：一次20～40 mg，溶于氯化钠注射液中，于肿瘤四周分点缓慢注入。

【制剂与规格】注射用硝卡芥：① 20 mg；② 40 mg。

(2) 铂类化合物类：铂类属细胞周期非特异性药物，抗瘤谱非常广泛，常用的抗肿瘤铂类化合物为顺铂（DDP）、卡铂（CBP）和奥沙利铂（L-OHP）。顺铂是

非小细胞肺癌、头颈部及食管癌、胃癌、卵巢癌、膀胱癌、恶性淋巴瘤、骨肉瘤及软组织肉瘤等实体瘤的首选药之一，卡铂抗瘤谱与顺铂类似，多用于非小细胞肺癌、头颈部及食管癌、卵巢癌等，而奥沙利铂是胃肠道癌常用药物，是结直肠癌的首选药物之一。常见不良反应包括消化道反应（恶心、呕吐、腹泻）、肾毒性、耳毒性、神经毒性、低镁血症等，也可出现骨髓抑制、过敏反应。由于分子结构上的差异，导致3种铂在药动学上存在不同，各自毒性亦有所区别，如顺铂显著不良反应为恶心、呕吐、肾毒性和耳毒性，骨髓抑制相对较轻；由卡铂引起的恶心和呕吐的严重程度比顺铂轻，在肾毒性、神经毒性和耳毒性方面的问题比顺铂少，但骨髓抑制比顺铂严重；奥沙利铂的神经毒性（包括感觉周围神经病）是剂量依赖性的，在累积量超过800 mg/m^2 时，在部分患者可导致永久性感觉异常和功能障碍。卡铂和奥沙利铂在糖溶液中稳定，使用中应采用5%葡萄糖溶解输注；在使用顺铂时应注意避光以保证药物的稳定性，大剂量（30 mg/m^2 以上）应用时，需要加强水化和利尿，肾毒性是大剂量顺铂化疗最常见、最严重的并发症之一，用顺铂后可致血清尿素氮及肌酐升高，通常发生于给药后10～15日，多为可逆性，个别严重者可致不可逆肾衰竭，目前尚无有效预防肾毒性的手段。顺铂进入循环后可直接与肾小管结合，破坏肾功能。化疗时严格按医嘱用药，用药后及时给予利尿药，一日水摄入量维持在3 000～3 500 ml，使尿量维持在2 500 ml以上，水化过程中注意观察液体超负荷病症并及时处理，定期检测血清电解质、肾功能情况，同时观察24小时尿量及尿颜色，鼓励患者多饮水，促进毒物排泄，以防尿酸结晶形成造成肾功能损害。必要时给予碳酸氢钠碱化尿液和别嘌醇，抑制尿酸形成，监测尿液的酸碱度，pH保持在6.5～7.0，准确记录24小时尿量，密切观察尿量变化，及时向医生报告。当然最好的措施是预防，对可能出现问题的要防患于未然，肾功能不全者慎用；因卡铂的代谢受到肌酐清除能力的影响较大，同样的剂量在不同的患者体中清除的速率相差极大，用体表面积进行计算并不可靠，故卡铂的剂量可根据患者的身高、体重、性别、年龄、血清肌酐水平计算肌酐清除率，然后按照所需AUC水平计算；由于遇冷可加重奥沙利铂的神经毒性，甚至可能因喉痉挛导致严重后果，临床使用奥沙利铂时及其后一段时间内应避免受凉，如禁冷饮、接触凉物及避风等。

顺铂[保（甲）]

Cisplatin

【适应证】用于小细胞与非小细胞肺癌、睾丸癌、卵巢癌、宫颈癌、子宫内膜癌、前列腺癌、膀胱癌、黑色素瘤、肉瘤、头颈部肿瘤及各种鳞状上皮癌和恶性淋巴瘤。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如既往有肾病史、造血系统功能不全、听神经功能障碍，用药前曾接受其他化疗或放射治疗及非顺铂引起的外周神经炎等。(2) 治疗前后，治疗期间和每1个疗程之前，应做如下检查，如肝肾功能、全血计数、血钙及听神经功能、神经系统功能等检查。此外，在治疗期间，每周应检查全血计数。通常需待器官功能恢复正常后，才能重复下1个疗程。(3) 化疗期间与化疗后，男女患者均需严格避孕。治疗后若想妊娠，需事先进行遗传学咨询。(4) 顺铂可能影响注意力集中，驾驶和机械操作能力。(5) 本品应避免接触铝金属（如铝金属注射针器等）。(6) 在化疗期间与化疗后，患者必须饮用足够的水分。

【禁忌证】对顺铂和其他铂化合物制剂过敏者、妊娠及哺乳期妇女、骨髓功能减退、严重肾功能损害、失水过多、水痘、带状疱疹、痛风、高尿酸血症、近期感染及因顺铂而引起的外周神经病等患者。

【不良反应】(1) 肾毒性：单次中、大剂量用药后，偶见轻微可逆的肾功能障碍，可出现微量血尿。多次高剂量和短期内重复用药，会出现不可逆的肾功能障碍，严重时肾小管坏死，导致无尿和尿毒症者。(2) 消化系统：可见恶心、呕吐、食欲减退和腹泻等，反应常在给药后1～6小时发生，最长不超过24～48小时；偶见肝功能障碍、ALT及AST增加，停药后可恢复。(3) 血液系统：白细胞计数或

血小板减少、一般与用药剂量有关，骨髓抑制一般在3周左右达峰，4～6周恢复。(4) 中枢神经系统：多见于总量超过300 mg/m²的患者，周围神经损伤多见，表现为运动失调、肌痛、上下肢感觉异常等；少数患者可能出现大脑功能障碍，亦可出现癫痫，球后视神经炎等；耳毒性以耳鸣和高频听力减低，多为可逆性，不需要特殊处理。(5) 过敏反应：可出现心率加快、血压降低、呼吸困难、面部水肿、变态性发热反应等。(6) 循环系统：少见心律失常、心电图改变、心功能不全等，也可有血管性病变，如脑缺血、冠状动脉缺血、外周血管障碍类似Ravnaud综合征等不良反应少见，但可能与顺铂使用有关。(7) 免疫系统：可出现免疫抑制反应。(8) 牙龈：牙龈可有铂金属沉积。(9) 生殖系统：可见精子、卵子形成障碍和男子乳房女性化等现象。继发性非淋巴细胞性白血病的出现与顺铂化疗使用有关。(10) 其他：高尿酸血症常出现腿肿胀和关节痛；电解质紊乱有低镁血症、低钙血症、肌肉痉挛。患者接受动脉或静脉注射的肢体可局部肿胀、疼痛、红斑及皮肤溃疡、局部静脉炎等。

【用法与用量】顺铂仅能由静脉、动脉或腔内给药。通常采用静脉滴注方式给药。给药前2～16小时和给药后至少6小时之内，必须进行充分的水化治疗。本品需用0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖溶液稀释后静脉滴注。剂量视化疗效果和个体反应而定。以下剂量供参考（适用于成年人及小孩）：单次化疗（4周1次），一次用量50～120 mg/m²；化疗一周1次，共2次，一次用量50 mg/m²；化疗一日1次，连用5日，一次用量15～20 mg/m²。疗效依临床疗效而定，3～4周重复疗程。本品可与其他抗癌药联合使用，单一使用亦可。联合用药时，用量需随疗程做适当调整。

【制剂与规格】注射用顺铂：① 10 mg；② 20 mg；③ 50 mg。

顺铂注射液：6 ml：30 mg。

顺铂氯化钠注射液：① 100 ml：顺铂100 mg与氯化钠900 mg；② 50 ml：顺铂50 mg与氯化钠450 mg。

卡铂[保(甲)]

Carboplatin

【适应证】用于卵巢癌、小细胞肺癌、非小细胞肺癌、头颈部鳞癌、食管癌、精原细胞瘤、膀胱癌、间皮瘤等。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如水痘、带状疱疹、感染、肾功能减退，老年患者。(2) 应用本品前应检查血象及肝肾功能，治疗期间至少每周检查1次白细胞计数与血小板。(3) 在用药期间，应随访检查：①听力；②神经功能；③血尿素氮、肌酐清除率与血清肌酐测定；④血细胞比容，血红蛋白测定，白细胞计数和分类与血小板计数；⑤血清钙、镁、钾、钠含量的测定。(4) 静脉注射时应避免漏于血管外。(5) 本品溶解后，应在8小时内用完。(6) 滴注及存放时应避免直接日晒。

【禁忌证】有明显骨髓抑制和肝肾功能不全者；对顺铂或其他铂类化合物过敏者；对甘露醇过敏者；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：骨髓抑制为剂量限制毒性，白细胞计数与血小板在用药21日后达最低点，通常在用药后30日左右恢复；粒细胞的最低点发生于用药后21～28日，通常在35日左右恢复；白细胞计数与血小板减少与剂量相关，有蓄积作用。(2) 过敏反应：常见皮疹、瘙痒，偶见喘咳，可发生于用药后几分钟之内；指或趾麻木或麻刺感；高频率的听觉丧失首先发生，耳鸣偶见，视物模糊、黏膜炎或口腔炎。(3) 消化系统：可见恶心、呕吐、便秘、腹泻、食欲减退、肝功能异常。(4) 中枢神经系统：可见脱发、头晕或注射部位疼痛。

【用法与用量】用5%葡萄糖注射液溶解本品，浓度为10 mg/ml，再加入5%葡萄糖注射液250～500 ml中静脉滴注。成人。按体表面积一次200～400 mg/m²，每3～4周给药1次；2～4次为1个疗程。也可采用按体表面积一次50 mg/m²，一日1次，连用5日，间隔4周重复。

【制剂与规格】卡铂注射液：① 10 ml：100 mg；② 15 ml：150 mg。

注射用卡铂：① 50 mg；② 100 mg。

奥沙利铂[保(乙)]

Oxaliplatin

【适应证】与氟尿嘧啶和亚叶酸联合应用。用于一线治疗转移性结直肠癌，辅助治疗原发肿瘤已完全切除后的Ⅲ期结肠癌术后的辅助治疗。

【注意事项】(1) 奥沙利铂应在专门的肿瘤机构内应用，并在有经验的肿瘤医师的监督下使用。(2) 对中度肾功能不全患者应用尚缺乏足够的安全性研究的资料。因此，此类患者用药前应该权衡利弊。此种情况下，必须密切监测肾功能，并按照毒性大小调整剂量。(3) 对于有铂类化合物过敏史的患者，应严密监测过敏症状。一旦发生任何过敏反应，应立即停止给药，并给予积极的对症治疗，并禁止在这些患者中再用奥沙利铂。(4) 如有外渗发生，应立即停止滴注并采取局部处理措施以改善症状。(5) 应仔细监测奥沙利铂的神经系统毒性，特别是与其他有神经系统毒性的药物合用时。一次治疗前都要进行神经系统检查，以后定期复查。(6) 如果以2小时内滴注完奥沙利铂的速度给药时，患者出现急性喉痉挛，下次滴注时，应将滴注时间延长至6小时。(7) 如果患者出现神经系统症状（感觉障碍、痉挛），那么依据症状持续的时间和严重程度推荐以下方法调整奥沙利铂的剂量。①如果症状持续7日以上而且较严重，应将奥沙利铂的剂量从85 mg/m^{2}减至65 mg/m^2（晚期肿瘤化疗）或至75 mg/m^2（辅助化疗）。②如果无功能损害的感觉异常一直持续到下一周期，奥沙利铂的剂量从85 mg/m^{2}减至65 mg/m^2（晚期肿瘤化疗）或至75 mg/m^2（辅助化疗）。③如果出现功能不全的感觉异常一直持续到下一周期，应停止应用奥沙利铂。④如果在停止使用奥沙利铂后，这些症状有所改善，可考虑继续奥沙利铂治疗。(8) 应告知患者治疗停止后，周围感觉神经病变症状可能持续存在。辅助治疗停止后，局部，中度感觉异常或影响日常活动的感觉异常可能持续3年以上。(9) 胃肠道毒性，主要表现为恶心和呕吐，建议给予预防性和治疗性止吐用药。(10) 严重的腹泻和（或）呕吐可能会引起脱水、麻痹性肠梗阻、肠闭塞、低血钾、代谢性酸中毒以及肾功能损伤，特别当奥沙利铂与氟尿嘧啶联合应用时，发生这些情况的可能性更大。(11) 如果出现血液学毒性（中性粒细胞＜1.5×10^9/L或血小板＜50×10^9/L），下一周期的治疗应推迟，直到血液学指标恢复到正常的水平。在奥沙利铂初次治疗前或新一周期奥沙利铂治疗前要进行血象检查。(12) 应告知患者服用奥沙利铂和氟尿嘧啶后发生腹泻、呕吐、黏膜炎、口腔炎及中性粒细胞减少等情况的危险性，并与他们的医师有密切接触以保证一旦发生问题时能采取适当的措施处理之。(13) 如发生黏膜炎、口腔炎，伴有或不伴有中性粒细胞减少、下次服药应推迟至黏膜炎、口腔炎恢复到至少1级，和（或）中性粒细胞水平≥1.5×10^9/L。(14) 奥沙利铂与氟尿嘧啶（联合或不联合亚叶酸）合用时，应根据氟尿嘧啶相关的毒性对其剂量做相应的调整。(15) 当腹泻达到4级、中性粒细胞减少症达到3～4级（中性粒细胞＜1.0×10^9/L）或血小板减少症达到3～4级（血小板＜50×10^9/L）时，须将奥沙利铂临床应用剂量从85 mg/m^{2}降到65 mg/m^2（晚期肿瘤化疗）或至75 mg/m^2（辅助化疗），并且相应调整氟尿嘧啶应用的剂量。(16) 如果有无法解释的呼吸系统症状发生，如无痰性干咳、呼吸困难、肺泡啰音或可有放射影像学依据的肺浸润，应立即停止应用该药直到肺部检查确定已排除发生间质性肺炎的可能为止。(17) 如果不能确定肝功能检查结果的异常或肝门静脉高压症是由肝转移引起的，应考虑由奥沙利铂引起的极少见的肝血管异常的可能性。

【禁忌证】对铂类衍生物有过敏者，第1个疗程开始前有骨髓抑制，第1个疗程开始前有周围感觉神经病变伴功能障碍，有严重肾功能不全者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见贫血、粒细胞减少、血小板减少、有时可达3级或4级。当与氟尿嘧啶联合应用时，中性粒细胞减少症及血小板减少症等血液学毒性增加。(2) 消化系统：可见恶心、呕吐、腹泻、便秘、轻度肝功能异常，上述

症状有时很严重；当与氟尿嘧啶联合应用时，这些不良反应显著增加。建议给予预防性或治疗性的止吐药。(3) 中枢神经系统：以末梢神经炎为特征的周围性感觉神经病变，有时可伴有口周、上呼吸道和上消化道的痉挛及感觉障碍、喉痉挛，接受寒冷刺激的常出现以上现象，故应该避免受凉（如接触凉水或吸入凉空气等）。感觉异常可在治疗休息期减轻，但在累积剂量＞800 mg/m²（6个周期）时，有可能导致永久性感觉异常和功能障碍。在治疗终止后数月之内，3/4以上患者的神经毒性可减轻或消失。当出现可逆性的感觉异常时，并不需要调整下一次本品的给药剂量。给药剂量的调整应以所观察到的神经症状的持续时间和严重性为依据。当感觉异常在两个疗程中间持续存在，疼痛性感觉异常和（或）功能障碍开始出现时，本品给药量应减少25%（或100 mg/m²），如在调整剂量之后症状仍持续存在或加重，应停止治疗。在症状完全或部分消失之后，仍有可能全量或减量使用，应根据医师的判断做出决定。(4) 呼吸系统：可有肺纤维化、间质性肺病。(5) 其他：用药后可见全身不适、皮疹；对心肾功能无影响；偶见脱发、耳毒性，本品药液渗漏在血管外可引起局部疼痛和炎症；罕见过敏，出现皮肤红斑甚至过敏性休克。

【用法与用量】限成人使用。①辅助治疗时，奥沙利铂的推荐剂量为85 mg/m²，加入5%葡萄糖溶液250～500 ml中静脉滴注2～6小时，2周重复1次，共12个周期（6个月）。②治疗转移性结直肠癌，奥沙利铂的推荐剂量为85 mg/m²静脉滴注，2周重复1次。应按患者的耐受程度进行调整剂量。③奥沙利铂和氟尿嘧啶联合使用，必须在氟尿嘧啶前使用。

【制剂与规格】注射用奥沙利铂：①50 mg；②100 mg。

奈达铂[保(乙)]

Nedaplatin

【适应证】用于头颈部癌、小细胞肺癌、非小细胞肺癌、食管癌等实体瘤。

【注意事项】(1) 听力损害、骨髓、肝、肾功能不良，合并感染和水痘患者及老年人慎用。(2) 本品有较强的骨髓抑制作用，并可能引起肝、肾功能异常。应用本品过程中应定期经常检查血液、肝、肾功能并密切注意患者的全身情况，若发现异常应停药并适当处置。对骨髓功能低下及肾功能不全及应用过顺铂者，应适当降低初次给药剂量；本品长期给药时，不良反应有增加的趋势，并有可能引起延迟性不良反应，应密切观察。(3) 注意出血倾向及感染性疾病的发生或加重。(4) 本品主要由肾脏排泄，应用本品过程中须确保充分的尿量以减少尿中药物对肾小管的毒性损伤。必要时适当输液及使用甘露醇、呋塞米等利尿药。由于有报道应用呋塞米等利尿药时，会加重肾功能障碍，听觉障碍，所以应进行输液等，以补充水分。另外，饮水困难或伴有恶心、呕吐、食欲缺乏、腹泻等的患者应特别注意。(5) 对恶心、呕吐、食欲缺乏等消化道不良反应应注意观察，并进行适当的处理。(6) 合用其他抗肿瘤药（氮芥类、抗代谢类、生物碱、抗生素等）及放疗可能使骨髓抑制加重。(7) 育龄患者应考虑本品对性腺的影响。(8) 本品仅供静脉滴注，药液应避免漏于血管外。 (9) 本品主要经肾脏排泄，由于一般老年人肾功能减退，排泄延迟，因此应注意观察出现骨髓抑制的可能性。建议老年患者初次用药剂量为80 mg/m²。

【禁忌证】(1) 有明显骨髓抑制及严重肝、肾功能不全者。(2) 对其他铂制剂及右旋糖酐过敏者。(3) 孕妇、可能妊娠及有严重并发症的患者。

【不良反应】本品主要不良反应为骨髓抑制，表现为白细胞、血小板、血红蛋白减少；其他较常见的不良反应包括恶心、呕吐、食欲减退、肝肾功能异常、耳神经毒性、脱发等。其他不良反应虽发生率较低，但应引起关注：(1) 严重不良反应：①过敏性休克(0.1%～5%)。②骨髓抑制；③肾功能异常(0.1%～5%)；④阿－斯综合征；⑤听觉障碍、听力低下、耳鸣；⑥间质性肺炎；⑦抗利尿激素分泌异常综合征(SIADH)。(2) 其他的不良反应：①神经系统：痉挛、头痛、手足发冷等末梢神经功能障碍、BUN升高(11.4%)、血清肌酐清除率低下(25.3%)、β_2小球

蛋白升高血尿、蛋白尿、少尿、代偿性酸中毒、尿酸升高、NAC 上升。②消化系统：恶心、呕吐（74.9%）、食欲减退（59.5%）、腹泻、肠梗阻、腹痛、便秘、口腔炎症等。③循环系统：心电图异常（心动过速、ST 波低下），心肌受损。④呼吸系统：呼吸困难。⑤泌尿系统：尿痛、排尿困难。⑥过敏症状：变态反应（湿疹、发红）、皮疹等。⑦肝脏：AST 升高（11.9%）、ALT 升高（12.3%）、胆红素升高、ALP 上升、LDH 升高、血清总蛋白减少、血清白蛋白降低。⑧电解质：钠、钾、氯等电解质异常。⑨其他：全身性疲倦、发热、静脉炎、水肿、潮红、疱疹、白细胞计数增多（一过性）。

【用法与用量】静脉滴注：临用前用氯化钠注射液溶解后，再稀释至 500 ml，滴注时间不应少于 1 小时，滴闭后需继续滴注输液 1 000 ml 以上。推荐剂量一次 80 ~ 100 mg/m^2，每疗程给药 1 次，间隔 3 ~ 4 周后方可进行下一个疗程。

【规格与规格】注射用奈达铂：① 10 mg；② 50 mg。

洛铂[保(乙)]

Lobaplatin

【适应证】用于治疗乳腺癌，小细胞肺癌及慢性粒细胞性白血病。

【注意事项】(1) 本品对骨髓有毒性，血小板严重减少和重度贫血患者，特别在罕见的出血病例中可能需要输血。(2) 在用药过程中应定期监测血常规（包括血小板、白细胞和血红蛋白）和临床血生化（包括 AST 及 ALT），在每个疗程前和每次用药后第 2 周进行检查。(3) 氯化钠注射液可促使本品降解，不能应用氯化钠注射液溶解。

【禁忌证】对铂类化合物过敏者、有骨髓抑制者、凝血机制障碍者（可增加出血危险或出血）、肾功能损害禁用。妊娠及哺乳期妇女禁用，对有生育功能的妇女，在应用本品治疗期间或终止治疗后 6 个月内应避免妊娠。

【不良反应】常见血小板、白细胞计数减少，并可引起由血小板减少所继发的出血和由白细胞减少所继发的感染；另常见恶心、呕吐、腹泻；少见过敏（疹性紫癜、皮肤潮红）、感觉异常、视觉异常、精神错乱、神经痛、耳毒性和肾毒性；偶见 AST 及 ALT 升高。

【用法与用量】静脉注射：一次 50 mg/m^2，临用前用注射用水 5 ml 溶解，此溶液应在 4 小时内应用并存放于 2 ~ 8℃，再次使用时待血液毒性和其他不良反应完全恢复，推荐使用间歇期为 3 周。如不良反应恢复较慢，可延长使用间歇期。治疗持续时间应依据肿瘤的反应，最少应使用 2 个疗程。如肿瘤开始缩小，可继续治疗，总数可达 6 个疗程。

【制剂与规格】注射用洛铂：① 10 mg；② 50 mg。

(3) 蒽环类及其他：抗肿瘤抗生素中以 DNA 为靶作用部位的药物主要包括丝裂霉素（MMC）和蒽环类抗生素，如多柔比星（ADM）、表柔比星（EPI）、吡柔比星（THP）。这些药物对多种人体肿瘤具有广谱的抗肿瘤活性，临床使用广泛。MMC 原来主要用于胃肠道癌，也可用于癌性胸腹水的治疗，但近年来已较少用于消化道肿瘤。蒽环类抗生素抗瘤谱非常广，为恶性淋巴瘤、乳腺癌、胃癌、骨肉瘤及软组织肉瘤的首选药物之一。骨髓抑制是这类药物共同的剂量限制性毒性，MMC 的骨髓抑制较为持久。近年来由于集落刺激因子的应用，可部分克服骨髓毒性，含蒽环类药物的剂量密集方案被成功应用于非霍奇金淋巴瘤和乳腺癌的治疗。蒽环类药物大部分通过胆管排泄，蒽环类抗生素可导致氧自由基形成，这可能与其心脏毒性有关，表现为剂量累积性的心肌病，大多发生于多柔比星总量 > 400 mg/m^2、表柔比星 > 900 mg/m^2 的患者，一般认为，表柔比星和吡柔比星的心脏毒性低于多柔比星，因此蒽环类抗生素慎用于有心脏病、高血压、高龄的和接受过心脏介入的患者；另外这类药物局部刺激性强，药物外渗可导致组织坏死，故必须确定静脉通畅后才能给药；一旦外渗应立即停止注射，并采用积极的解救措施。

多柔比星（阿霉素）[保（甲）]

Doxorubicin

【适应证】用于急性白血病（淋巴细胞性和粒细胞性）、恶性淋巴瘤、乳腺癌、肺癌（小细胞和非小细胞肺癌）、卵巢癌、骨及软组织肉瘤、肾母细胞瘤、神经母细胞瘤、膀胱癌、甲状腺癌、前列腺癌、头颈部鳞癌、睾丸癌、胃癌和肝癌等。

【注意事项】(1) 少数患者用药后可引起黄疸或其他肝功能损害，有肝功能不全者，用量应予酌减。(2) 经肾排泄虽较少，但在用药后 1 ~ 2 日可出现红色尿，一般都在 2 日后消失。肾功能不全者用本品后要警惕高尿酸血症的出现；痛风患者，如应用多柔比星，别嘌醇用量要相应增加。(3) 下列情况慎用，如 2 岁以下幼儿，老年患者。(4) 在用药期间，应监测：①用药前后要测定心功能、心电图、超声心动图、血清酶学和其他心肌功能试验；②随访检查周围血象（每周至少 1 次）和肝功能试验；③应经常查看有无口腔溃疡、腹泻及黄疸等情况，应劝患者多饮水以减少高尿酸血症的可能，必要时检查血尿酸或肾功能。(5) 过去曾用过足量柔红霉素、表柔比星及本品者不能再用。(6) 本品可用于浆膜腔内给药和膀胱灌注，但不能用于鞘内注射。(7) 在进行纵隔或胸腔放疗期间禁用本品，以往接受过纵隔放射治疗者，多柔比星的一次用量和总剂量亦应酌减。(8) 外渗后可引起局部组织坏死，需确定静脉通畅后才能给药。

【禁忌证】曾用其他抗肿瘤药或放疗已引起骨髓抑制者，心肺功能失代偿患者、严重心脏病患者、妊娠及哺乳期妇女、周围血象白细胞计数 $< 3.5 \times 10^9$/L 或血小板 $< 50 \times 10^9$/L 者、明显感染或发热、恶病质、失水、电解质或酸碱平衡失调患者，胃肠道梗阻、明显黄疸或肝功能损害患者、水痘或带状疱疹患者。

【不良反应】(1) 血液系统：骨髓抑制为其主要不良反应。白细胞计数约于用药后 10 ~ 14 日下降至最低点，大多在 3 周内逐渐恢复至正常水平，贫血和血小板减少一般不严重。(2) 循环系统：可出现一过性心电图改变，表现为室上性心动过速、室性期前收缩及 ST-T 段改变，一般不影响治疗，少数患者可出现延迟性进行性心肌病变，表现为急性充血性心力衰竭，与累计剂量密切相关，大多出现在总量 > 400 mg/m^2 的患者，这些情况偶尔可突然发生而常规心电图无异常迹象，多柔比星引起的心脏病变多出现在停药后 1 ~ 6 个月，心脏毒性可因联合应用其他药物加重。(3) 消化系统：可见食欲减退、恶心、呕吐、口腔黏膜红斑、溃疡、食管炎、胃炎。(4) 皮肤与软组织：脱发发生率为 90% 以上，一般停药 1 ~ 2 个月可恢复生长。(5) 局部反应：如注射处药物外渗可引起组织溃疡和坏死。药物浓度过高引起静脉炎。少数患者有发热、出血性红斑、肝功能异常与蛋白尿、甲床部位出现色素沉着、指甲松离，在原先放射野可出现皮肤发红或色素沉着。个别患者出现荨麻疹、过敏反应、结膜炎、流泪。此外多柔比星可增加放疗和一些抗癌药毒性。白血病和恶性淋巴瘤患者应用本品时，特别是初次使用者，可因瘤细胞大量破坏引起高尿酸血症，而致关节痛或肾功能损害。

【用法与用量】静脉冲入、静脉滴注或动脉注射。临用前加灭菌注射用水溶解，浓度为 2 mg/ml。成人，静脉冲入。①单药 50 ~ 60 mg/m^2，3 ~ 4 周 1 次或一日 20 mg/m^2，连用 3 日，停用 2 ~ 3 周后重复。②联合用药为 40 mg/m^2，3 周 1 次或 25 mg/m^2，一周 1 次，连续 2 周，3 周重复。总剂量一般不宜超过 450 mg/m^2。分次用药心肌毒性、骨髓抑制、胃肠道反应（包括口腔溃疡）较 3 周一次为轻。

【制剂与规格】注射用多柔比星：① 10 mg；② 50 mg。

表柔比星[保（乙）]

Epirubicin

【适应证】用于恶性淋巴瘤、乳腺癌、肺癌、软组织肉瘤、食管癌、胃癌、肝癌、胰腺癌、黑色素瘤、结肠直肠癌、卵巢癌、多发性骨髓瘤、白血病。膀胱内给药有助于浅表性膀胱癌、原位癌的治疗和预防其经尿道切除术后的复发。

【注意事项】(1) 肝肾功能影响：肝功能不全者应减量，以免蓄积中毒；中度

肾功能受损患者无需减少剂量，因为仅少量的药物经肾脏排出。使用本品因肿瘤细胞的迅速崩解而引起高尿酸血症。应检查血尿酸水平。另外，在用药 1 ~ 2 日可出现尿液红染。(2) 心脏毒性：可导致心肌损伤，心力衰竭；对目前或既往接受纵隔、心包区合并放疗的患者，表柔比星心脏毒性的潜在危险可能增加；在确定表柔比星最大蓄积剂量时，与任何具有潜在心脏毒性药物联合用药时应慎重；在每个疗程前后都应进行心电图检查；当表柔比星总累积剂量超过 900 mg/m^2 时进展行 CHF 的发生率明显增高，并有引起原发性心肌症的风险，超过该累积剂量的使用需要非常小心。(3) 骨髓抑制：可引起白细胞计数及血小板减少、应定期进行血液学监测。(4) 给药说明：①静脉给药，用灭菌注射用水稀释，使其终浓度不超过 2 mg/ml。②建议先注入 0.9%氯化钠注射液检查输液管通畅性及注射针头确实在静脉之后，再经此通畅的输液管给药。以此减少药物外溢的危险，并确保给药后静脉用盐水冲洗。③表柔比星注射时溢出静脉会造成组织的严重损伤甚至坏死。小静脉注射或反复注射同一血管会造成静脉硬化。建议以中心静脉输注较好。④不可肌内注射和鞘内注射。(5) 继发性白血病：可伴或不伴白血病前期症状。下列情况下出现继发性白血病更为常见，当与作用机制为破坏 DNA 结构的抗癌药合用时；或患者既往多次使用细胞毒药物治疗；或蒽环类治疗剂量有所提升时。潜伏期一般为 1 ~ 3 年。(6) 对生殖系统的影响：本品能破坏精子染色体，接受本品治疗的男性患者应避孕。本品可能引起绝经前妇女闭经或绝经期提前。

【禁忌证】因用化疗或放疗而造成明显骨髓抑制的患者；已用过大剂量蒽环类药物（如多柔比星或柔红霉素）的患者；近期或既往有心脏受损病史的患者；血尿患者膀胱内灌注；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】与多柔比星相似，但程度较低，尤其是心脏毒性和骨髓抑制毒性。其他不良反应有脱发、男性有胡须生长受抑、黏膜炎（常见舌侧及舌下黏膜）、胃肠功能紊乱、恶心、呕吐、腹泻，偶见发热、寒战、荨麻疹、色素沉着、关节痛。注射部位如有药液外溢，可致红肿、局部疼痛、蜂窝织炎或坏死。罕见肝肾功能损害，有慢性肝病或肝转移时可引起 ALT 及 AST 升高或黄疸。

【用法与用量】(1) 常规剂量：表柔比星单独用药时，成人剂量为按体表面积一次 60 ~ 120 mg/m^2，当表柔比星用来辅助治疗腋下淋巴阳性的乳腺癌患者联合化疗时，推荐的起始剂量为 100 ~ 120 mg/m^2 静脉注射，每个疗程的总起始剂量可以一次单独给药或者连续 2 ~ 3 日分次给药。根据患者血象可间隔 21 日重复使用。(2) 优化剂量：高剂量可用于治疗肺癌和乳腺癌。单独用药时，成人推荐起始剂量为按体表面积一次最高可达 135 mg/m^2，在每 1 个疗程的第 1 日一次给药或在每疗程的第 1、2、3 日分次给药，3 ~ 4 周 1 次。联合化疗时，推荐起始剂量按体表面积最高可达 120 mg/m^2，在每 1 个疗程的第 1 日给药，3 ~ 4 周 1 次。静脉注射给药。根据患者血象可间隔 21 日重复使用。(3) 膀胱内给药：表柔比星应用导管灌注并应在膀胱内保持 1 小时左右。在灌注期间，患者应时常变换体位，以保证膀胱黏膜能最大面积地接触药物。为了避免药物被尿液不适当的稀释，应告知患者灌注前 12 小时不要饮用任何液体。医师应指导患者在治疗结束时排空尿液。浅表性膀胱癌，表柔比星 50 mg 溶于 0.9%氯化钠注射液 25 ~ 50 ml 中，一周 1 次，灌注 8 次。对于有局部毒性（化学性膀胱炎）的病例，可将一次剂量减少至 30 mg，患者也可接受 50 mg，一周 1 次，共 4 次，然后 1 个月 1 次，共 11 次的同剂量药物膀胱灌注。医师可根据患者病情调整给药次数。

【制剂与规格】注射用盐酸表柔比星：① 10 mg；② 50 mg。

吡柔比星 [保(乙)]

Pirarubicin

【适应证】对恶性淋巴瘤和急性白血病有较好疗效，对乳腺癌、头颈部癌、胃癌、泌尿系统恶性肿瘤、卵巢癌、子宫内膜癌、子宫颈癌等有效。单用 THP 的有效率分别为 20% ~ 70%。与多种化疗药物

如 Ara-C、CTX、6-MP、MTX、5-FU、DDP 等联合应用抗癌作用增加。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如合并感染、水痘等症状的患者。(2) 儿童及生长期的患者用药时注意对性腺影响。(3) 高龄者酌情减量。(4) 严格避免注射时渗漏至血管外，密切监测心脏、血象、肝肾功能及继发感染等情况。原则上每周期均要进行心电图检查。(5) 溶解本品只能用 5% 葡萄糖注射液或注射用水，以免 pH 的原因影响效价或浑浊。(6) 溶解后的药液，即时用完，室温下放置不得超过 6 小时。

【禁忌证】对本品过敏者，严重器质性心脏病或心功能异常者，妊娠期、哺乳及育龄期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：骨髓抑制为剂量限制性毒性，主要为粒细胞计数减少、平均最低值在第 14 日，第 21 日恢复，贫血及血小板减少少见。(2) 循环系统：心脏毒性低于 ADM，急性心脏毒性主要为可逆性心电图变化，如心律失常或非特异性 ST-T 段异常，慢性心脏毒性呈剂量累积性。(3) 消化系统：可见恶心、呕吐、食欲减退、口腔黏膜炎，有时出现腹泻；肝肾功能异常。(4) 皮肤及软组织：可见脱发、皮肤色素沉着等，偶见皮疹。(5) 局部反应：膀胱内注射可出现尿频、排尿痛、血尿等膀胱刺激症状，甚至膀胱萎缩。

【用法与用量】将本品加入 5% 葡萄糖注射液或注射用水 10 ml 溶解。可静脉、动脉、膀胱内注射。(1) 静脉注射：一般按体表面积一次 25 ~ 40 mg/m^2。(2) 动脉给药：如头颈部癌按体表面积一次 7 ~ 20 mg/m^2，一日 1 次，共用 5 ~ 7 日，亦可一次 14 ~ 25 mg/m^2，一周 1 次。(3) 膀胱内给药：按体表面积一次 15 ~ 30 mg/m^2，稀释为 500 ~ 1 000 μg/ml 浓度，注入膀胱腔内保留 1 ~ 2 小时，一周 3 次为 1 个疗程，可用 2 ~ 3 个疗程。

【制剂与规格】注射用盐酸吡柔比星：① 10 mg；② 20 mg。

柔红霉素[保(甲)]

Daunorubicin

【适应证】(1) 急性粒细胞性白血病：无论是单一使用柔红霉素或者与其他抗肿瘤药物合用，柔红霉素均适用于治疗该病的各个分期。亦用于治疗早幼粒性白血病。(2) 急性淋巴细胞性白血病：用柔红霉素治疗该病，缓解率很高，但由于其不良反应大及尚有其他有效治疗方法，故柔红霉素只适用于那些对其他药物已产生耐药的病例。在急淋急性期联合使用柔红霉素、泼尼松和长春新碱已证实十分成功。(3) 其他肿瘤：已观察到柔红霉素对神经母细胞瘤及横纹肌肉瘤有良好的疗效。

【注意事项】(1) 在急性白血病诱导缓解期使用柔红霉素的患者须住院，治疗在持续的监控下进行。(2) 柔红霉素可迅速溶解肿瘤细胞而致血中尿素和尿酸升高。在治疗的第一周，至少需监测 3 ~ 4 次血浆尿素和尿酸水平。在严重的病例中，应给予充足的液体和别嘌醇，以避免尿酸性肾病。(3) 柔红霉素对所有患者都有骨髓抑制作用，对某些患者甚至有严重的骨髓再生障碍。所以在开始治疗之前，应时常注意药物的骨髓毒性，从而做好充分的支持疗法准备，如应用抗生素、输血、输血小板成分，最后也可输白细胞计数。治疗的第一周必须每日检查白细胞计数、红细胞及血小板数。(4) 在治疗开始及治疗期，提倡用一般实验室的检验如测 ALT 及 AST、碱性磷酸酶 (AKP)、胆红素和 BSP 来评估患者的肝功能。(5) 必须特别注意，柔红霉素引起的心脏毒性。如果柔红霉素的累积总量在 20 mg/kg 的限量以下，心力衰竭的危险性较小，大约 2%。但如累积总量过高，则发生率就相应增加。联合治疗（放疗及应用其他潜在心脏毒性的药物治疗）或有与病症相关的临床情况，如贫血、感染、心包或心肌浸润都会加强柔红霉素的心脏毒性。心力衰竭有可能在完全缓解期发生或在停用柔红霉素治疗几周后发生，而且一般常用的内科治疗并不能改善心力衰竭。每一治疗周期之前及之后，都值得做基础心电图。心电图的改变，如 T 波低平或倒置，或 ST 段下降，或心律失常发作，并不认为是停止用药的指征。现在认为 QRS 波低电压是心脏毒性较为特异的表现。如果发生 QRS 波低电压，须慎重权衡继续用药治疗的益处与发生不

可逆心脏损害危险性两者间的利害关系。在累积总量很高时，心力衰竭可随时发生，而心电图预先无任何改变。(6) 柔红霉素引起男性和女性不育，引起畸胎或对胎儿造成损害的可能性尚未得到足够评估。实验室资料显示柔红霉素可能引起胎儿生存率下降。故此，须慎重权衡孕妇用药的益处与药物对胎儿或胚胎潜在毒性两者间的利害关系。有报道指出，柔红霉素像其他抗肿瘤药物和免疫抑制药一样对特定实验模型动物有潜在致癌作用。(7) 注射柔红霉素1～2日后，尿液可呈橘红色。如果皮肤或黏膜意外接触到柔红霉素溶液，应立即彻底冲洗，虽然柔红霉素显示有部分抗菌活性，但决不用作抗生素。

【禁忌证】柔红霉素因有增加心脏毒性作用的危险而不适用于那些有心脏病史的患者；对有严重或有潜在心脏病患者；对有严重感染患者；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】骨髓抑制及心脏毒性是最重要的不良反应；脱发是常见不良反应，不过治疗停止后可恢复正常；口腔炎如不是由于肿瘤本身所表现的，会在注射药物5～10日后出现，其特点是溃烂区域的疼痛，尤其是在舌两侧及舌下黏膜区域；另可出现消化道症状，如恶心、呕吐、腹泻。如注射柔红霉素时发生药物外渗会导致严重的坏死；选用小静脉或一条静脉重复多次注射，可造成静脉硬化症。

【用法与用量】柔红霉素口服无效。须避免肌内注射或鞘内注射。只能静脉注射给药。应先静脉滴注0.9%氯化钠注射液，以确保针头在静脉内，然后才在这一通畅的静脉输液管内注射柔红霉素。这项技术可减少药物外渗的危险性及保证在注射完毕后可冲洗静脉。柔红霉素切不可与肝素混合，因这类药物在化学性质上不相配伍，可产生沉淀物，柔红霉素可与其他抗白血病药物联合应用，但切不可用同一针筒来混合这些药物。单一剂量从0.5～3 mg/kg。0.5～1 mg/kg的剂量须间隔1日或以上，才可重复注射；而2 mg/kg的剂量则须间隔4日或以上才可重复注射。虽然很少应用2.5～3 mg/kg的剂量，这个剂量须间隔7～14日才可重复注射。每个患者需要注射的次数不同。每个患者应根据各自对药物的反应和耐受性，应根据各自的血象和骨髓象情况来调整剂量，亦应考虑与其他抗肿瘤药物合用时，应调整剂量。无论成人或儿童，总剂量不能超过20 mg/kg。肝功能不良的患者须减量，以避免药物毒性的增强。

【制剂与规格】注射用盐酸柔红霉素：① 10 mg；② 20 mg。

米托蒽醌[保(乙)]

Mitoxantrone

【适应证】用于恶性淋巴瘤、乳腺癌、急性白血病、肺癌、黑色素瘤、软组织肉瘤、多发性骨髓瘤、肝癌、大肠癌、肾癌、前列腺癌、子宫内膜癌、睾丸肿瘤、卵巢癌和头颈部癌。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如一般情况差，有并发病及心、肺功能不全者。(2) 在用药期间，应严格检查血象。(3) 有心脏疾病，用过蒽环类药物或胸部照射的患者，应密切注意心脏毒性的发生。(4) 用药时应注意避免药液外溢，如发现外溢应立即停止，再从另一静脉重新进行。(5) 本品不宜与其他药物混合注射。(6) 本品遇低温可能析出晶体，可将安瓿置热水中加温，晶体溶解后使用。

【禁忌证】对本品过敏者；对肝功能不全或骨髓抑制者；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见对骨髓抑制，可引起白细胞计数和血小板减少、为剂量限制性毒性；少见心悸、期前收缩、心电图异常、恶心、呕吐、食欲减退、腹泻等；偶见乏力、脱发、皮疹、口腔炎等。

【用法与用量】将本品溶于50 ml以上的0.9%氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液中滴注，时间不少于30分钟。静脉滴注：单用本品，按体表面积一次12～14 mg/m^2，3～4周1次；或按一次4～8 mg/m^2，一日1次，连用3～5日，间隔2～3周。联合用药，一次5～10 mg/m^2。

【制剂与规格】盐酸米托蒽醌注射液：2 ml : 2 mg。

丝裂霉素[保(甲)]

Mitomycin

【适应证】用于胃癌、结肠及直肠癌、

肺癌、胰腺癌、肝癌、宫颈癌、宫体癌、乳腺癌、头颈部肿瘤、膀胱肿瘤。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肝损害或肾损害，骨髓功能抑制，合并感染症，水痘患者。(2) 小儿用药应慎重，尤应注意不良反应的出现，并考虑对性腺的影响。(3) 有时会引起骨髓功能抑制等严重不良反应，故应频繁进行临床检验（血液检查、肝功能及肾功能检查等），注意观察患者状态。若出现异常应减量或暂停并适当处置。另外，长期用药会加重不良反应呈迁延性推移，故应慎重给药。(4) 充分注意感染症、出血倾向的出现或恶化。(5) 给药时：①静脉内给药时，有时会引起血管痛、静脉炎，血栓，故应充分注意注射部位和注射方法等，尽量减慢注射速度。②静脉内给药时，若药液从血管渗漏，则会引起注射部位硬结、坏死，故应慎重给药以免药液渗漏。③动脉内给药时，有时会出现动脉支配区域的疼痛、发红、红斑、水疱、糜烂、溃疡等皮肤损害，导致皮肤及肌肉坏死，若出现此类症状应停药并适当处置。④肝动脉内给药时，会因药液流入靶位以外的动脉而引起胃及十二指肠溃疡、出血、穿孔等，故应以造影等方法充分确认导管先端位置及药物分布范围，随时注意导管的脱逸、移动、注入速度等。另外，若出现此类症状应停药并适当处置。(6) 配制方法：使用低 pH 溶液有时会降低效价，故溶解后尽快使用为宜。另外，尽量避免同低 pH 的注射剂配伍。水溶液状态易受 pH 影响，在 pH 8.0 时稳定，但在 pH 7.0 以下时，随 pH 下降其稳定性也降低。(7) 本品与其他抗恶性肿瘤药物合用有时会发生急性白血病（有时伴有白血病前相）、骨髓增生异常综合征（MDS）。

【禁忌证】对本品成分过敏者、水痘或带状疱疹、妊娠及哺乳期妇女。用药期间禁止活病毒疫苗接种。

【不良反应】(1) 血液系统：可见溶血性尿毒综合征、微血管性溶血性贫血；若出现伴有破碎红细胞的贫血、血小板减少、肾功能降低等症状，应停药并适当处置。另可见全血细胞减少、白细胞计数减少、中性粒细胞减少、血小板减少、出血、贫血等骨髓功能抑制。(2) 泌尿系统：可见膀胱炎、膀胱萎缩、急性肾衰竭等严重肾功能损害，若出现 BUN、肌酐及肌酐清除率值等异常，应及时停药并适当处置。(3) 呼吸系统：可见间质性肺炎、肺纤维化（伴发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 线片异常、嗜酸性粒细胞增多）等，若出现此类症状，应停药并给予糖皮质激素进行适当处置；(4) 消化系统：可见食欲减退、恶心、呕吐、口内炎、腹泻。(5) 其他：可见蛋白尿、血尿、水肿、高血压、皮疹、疲乏、脱发等反应。

【用法与用量】(1) 间歇给药方法：成人通常一日 4 ~ 6 mg（效价），一周静脉注射 1 ~ 2 次。(2) 连日给药法：成人通常一日 2 mg（效价），连日静脉注射。(3) 大量间歇给药法：成人通常一日 10 ~ 30 mg(效价)，间隔 1 ~ 3 周以上静脉注射。(4) 与其他抗恶性肿瘤药物合用：成人通常 1 日 2 ~ 4 mg（效价），每周与其他抗恶性肿瘤药物合用 1 ~ 2 次。另外，必要时成人通常一日 2 ~ 10 mg（效价），注入动脉内、髓腔内或胸腔及腹腔内。应随年龄及症状适宜增减。(5) 注射液的配制方法：每 2 mg（效价）丝裂霉素以 5 ml 注射用水溶解。(6) 膀胱肿瘤：预防复发时，一日 1 次或隔日 4 ~ 10 mg（效价）丝裂霉素。治疗时，一日 1 次膀胱内注射 10 ~ 40 mg（效价）丝裂霉素。应随年龄及症状适宜增减。

【制剂与规格】注射用丝裂霉素：① 2 mg；② 10 mg；③ 20 mg。

博来霉素[保(乙)]

Bleomycin

【适应证】用于皮肤恶性肿瘤、头颈部肿瘤（颌癌、舌癌、唇癌、咽部癌、口腔癌等）、肺癌（尤其是原发和转移性鳞癌）、食管癌、恶性淋巴瘤（网状细胞肉瘤、淋巴肉瘤、霍奇金瘤）、子宫颈癌、神经胶质瘤、甲状腺癌。

【注意事项】(1) 本品所致不良反应的个体差异显著，即使投用较少剂量，也可出现不良反应。应从小剂量开始使用。(2) 总用量应在 300 mg（效价）以下。(3) 儿童及生育年龄患者，应考虑对性腺

的影响。(4) 应用同类药物者，原则是博来霉素与该药剂量总和，为总用药量。(5) 间质性肺炎、肺纤维化，捻发音是最初出现的体征。发现异常时应该立即停药，按特发性肺纤维化处置，给予糖皮质激素及抗生素预防继发感染。(6) 肺功能基础较差者，间质性肺炎及肺纤维化出现频率较高，总剂量应在 150 mg 以下。(7) 用药过程中出现发热、咳嗽、活动性呼吸困难等，应立即停药。进行胸部 X 线检查、血气分析（A-aDo2）、动脉氧分压、一氧化碳扩散度等相关检查。随后 2 个月定期检查。(8) A-aDo2, Pao2 等每周检查一次，持续 2 周以上。出现下降时应立即停药。当 A-aDo2, Pao2 比用药前低 10Torr 以上，结合临床表现，怀疑药物引起时，应立即停药，同时给予激素治疗。当 Dlco 比用药前低 15%，亦按以上处理。用药前如肺功能检查数值较低，应慎重。如检查值有降低趋势，应立即停药。(9) 长期使用博来霉素，不良反应有增加及延迟性发生倾向，应十分注意。(10) 避免药物接触眼睛。用手涂抹黏膜附近病变后，应立即洗手。

【禁忌证】对本类药物有过敏史；严重肺部疾病，严重弥漫性肺纤维化；严重肾功能障碍；严重心脏疾病；胸部及其周围接受放射治疗者；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见间质性肺炎、肺纤维化、白细胞计数减少；少见食欲减退、恶心、呕吐、厌食、口内炎、腹泻、皮疹、荨麻疹、发热伴红皮症；罕见休克发生，特别是第一、二次用药量要少；注意病变因药物引起坏死出血、脱发、皮炎、色素沉着、发红、糜烂、皮肤增厚、指甲颜色改变、肝功异常、残尿感、尿频、尿痛、头痛、嗜睡、发热、全身不适、注射部位静脉壁肥厚，管腔狭窄、硬结、肿瘤部位疼痛等。

【用法与用量】(1) 肌内、皮下注射：博来霉素 15 ~ 30 mg（效价），溶于 0.9% 氯化钠注射液 5 ml 后使用。如病变周边皮下注射，以不高于 1 mg（效价）/ml 浓度为宜。肌内注射应避开神经，局部可引起硬结，应不断更换注射部位。(2) 动脉注射：博来霉素 5 ~ 15 mg（效价）溶于 0.9% 氯化钠注射液或葡萄糖液中，直接弹丸式动脉注射或连续灌注。(3) 静脉注射：博来霉素 15 ~ 30 mg（效价）溶于注射用水或 0.9% 氯化钠注射液 5 ~ 20 ml 中，缓慢静脉注入。出现严重发热反应时，一次静脉给药剂量应减少到 5 mg 以下。可增加给药次数，如一日 2 次。静脉注射可引起血管疼痛，应注意注射速度。尽可能缓慢给药。注射频率，通常一周 2 次，根据病情可增加为一日 1 次或减少为一周 1 次。总剂量，以肿瘤消失为治疗终止目标。总剂量 300 mg 效价以下。

【制剂与规格】注射用盐酸博来霉素：15 mg（效价）。

平阳霉素 [保(甲)]

Pingyangmycin

【适应证】用于唇癌、舌癌、齿龈癌、鼻咽癌、皮肤癌、乳腺癌、宫颈癌、食管癌、阴茎癌、外阴癌、恶性淋巴癌、坏死性肉芽肿、肝癌及翼状胬肉。

【注意事项】(1) 出现过敏症状时应停药。(2) 给药后如患者出现发热可给予退热药，对出现高热的患者再用药时应减少剂量，缩短给药时间，并在用药前后给予解热药或抗过敏药。(3) 有肺、肝肾功能不全者慎用。(4) 出现咳嗽、咳痰、呼吸困难等肺炎样症状，同时胸部 X 线片出现异常应停药，并给予糖皮质激素和适当的抗生素。(5) 偶尔出现休克样症状（低血压、发冷、发热、喘鸣、意识模糊等）应停药。

【禁忌证】对博来霉素类抗生素有过敏史的患者。

【不良反应】可见发热、食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、口腔炎、肝肾功能损伤、色素沉着、角质增厚、指甲变形、皮炎、皮疹、脱发、肿瘤处疼痛、静脉炎、血管痛、肺炎样病变、肺纤维化和过敏反应，极个别患者可发生过敏性休克。

【用法与用量】(1) 静脉注射：用 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 5 ~ 20 ml 溶解本品以 4 ~ 15 mg（效价）/ml 的浓度注射。(2) 肌内注射：用氯化钠注射液 5 ml 以下溶解本品 4 ~ 15 mg（效价）/ml 的浓度注射。(3) 动脉注射：用 3 ~ 25 ml 添加有抗凝药（如肝素）的氯化钠

注射液溶解本品 4 ~ 8 mg（效价）做一次动脉内注射或持续动脉内注射。(4) 肿瘤内注射：用于治疗淋巴管瘤，一次 4 ~ 8 mg，加 2 ~ 4 ml 注射用水溶解，有囊者尽可能抽尽囊内液后注药，间歇期至少 1 个月，5 次为 1 个疗程。治疗血管瘤，一次 4 ~ 8 mg，加氯化钠注射液或利多卡因注射液 3 ~ 5 ml 溶解，注入瘤体内，注射 1 次未愈者，间歇 7 ~ 10 日重复注射，总量一般不超过 70 mg（效价）。

【制剂与规格】注射用盐酸平阳霉素：8 mg。

10.3.1.2 影响核酸合成的药物

此类药属细胞周期特异性抗肿瘤药，其化学结构与体内某些代谢物相似，但不具备其功能，干扰核酸蛋白质的生物合成和利用，导致肿瘤细胞死亡。该类药物包括 ①二氢叶酸还原酶抑制药，如甲氨蝶呤、培美曲塞；②胸腺核苷合成酶抑制药，如氟尿嘧啶、卡培他滨；③嘌呤核苷合成酶抑制药，如巯嘌呤、硫鸟嘌呤；④核苷酸还原酶抑制药，如羟基脲；⑤ DNA 多聚酶抑制药，如阿糖胞苷、吉西他滨。常用药物包括甲氨蝶呤、嘌呤和嘧啶衍生物等。

(1) 二氢叶酸还原酶抑制药：甲氨蝶呤不可逆性抑制二氢叶酸还原酶，之后胸腺嘧啶核苷合成酶也受到抑制，使细胞阻断在 S 期。还原型叶酸不足，导致嘌呤及胸腺嘧啶核苷酸合成的障碍，抑制 DNA、RNA 及蛋白质合成。甲氨蝶呤用于治疗儿童急性淋巴细胞白血病、绒毛膜癌、非霍奇金淋巴瘤及许多实体瘤。鞘内注射甲氨蝶呤用于治疗急性淋巴细胞白血病颅内受侵或缓解后预防 CNS 受侵及脑膜转移癌。目前临床经常采用 HD-MTX-CFR（大剂量甲氨蝶呤，CF 解救），指一次使用比常规剂量大 100 倍（20 mg/kg 以上或 1.0 g/ 次）以上的甲氨蝶呤静脉滴注 4 ~ 6 小时，可用于骨肉瘤、高度恶性非霍奇金淋巴瘤的一线治疗。另一种二氢叶酸还原酶抑制药为多靶点抗叶酸代谢培美曲塞，可同时抑制胸苷酸合成酶、二氢叶酸还原酶、甘氨酸核糖核苷甲酰基转移酶（GARFT）等叶酸依赖性酶，通过干扰细胞复制过程中叶酸依赖性代谢过程而发挥作用。顺铂联合培美曲塞可用于恶性胸膜间皮瘤，单药培美曲塞用于晚期或转移性非小细胞癌的二线治疗。

甲氨蝶呤 [保（甲）]

Methotrexate

【适应证】用于乳腺癌、妊娠性绒毛膜癌、恶性葡萄胎或葡萄胎、急性白血病、恶性淋巴瘤、非霍奇金淋巴瘤、蕈样肉芽肿、多发性骨髓瘤、卵巢癌、宫颈癌、睾丸癌、头颈部癌、支气管肺癌、软组织肉瘤，高剂量用于骨肉瘤，鞘内注射用于预防和治疗脑膜白血病及恶性淋巴瘤的神经侵犯，银屑病。

【注意事项】(1) 长期应用存在导致继发性肿瘤的风险。(2) 影响生殖功能。(3) 全身极度衰竭、恶病质或并发感染及心、肺、肝、肾功能不全时禁用本品。(4) 白细胞计数 $< 3.5 \times 10^9/L$ 或血小板 $< 50 \times 10^9/L$ 时不宜使用。(5) 有肾病史或发现肾功能异常时，未准备好解救药亚叶酸钙（CF），未充分进行液体补充或碱化尿液时，禁用大剂量疗法。大剂量疗法须经住院并随时监测其血药浓度。(6) 滴注时间不宜超过 6 小时。

【禁忌证】对本品高度过敏者，妊娠及哺乳期妇女，肾功能已受损害，营养不良，肝肾功能不全或伴有血液疾病者。

【不良反应】(1) 血液系统：可见白细胞计数减少、血小板减少、贫血、丙种球蛋白减少、多部位出血、败血症。(2) 消化系统：可见口腔炎、口唇溃疡、咽喉炎、恶心、呕吐、食欲减退、厌食、腹痛、腹泻、黑粪、消化道溃疡和出血、肠炎、急性肝萎缩和坏死、黄疸、ALT 及 AST 升高、碱性磷酸酶升高、γ-谷氨酰转肽酶升高、脂肪变性、肝门静脉纤维化。(3) 泌尿系统：可见肾衰竭、氮质血症、膀胱炎、血尿、蛋白尿、少尿、尿毒症。(4) 呼吸系统：可见咳嗽、气短、肺炎、肺纤维化。(5) 皮肤及软组织：可见红斑、瘙痒、皮疹、光敏感、脱色、瘀斑、毛细血管扩张、痤疮、疖病、脱发。(6) 中枢神经系统：可见眩晕、头痛、视物模糊，失语症，轻度偏瘫和惊厥。(7) 生殖系统：短期精液减少、月经不调、不育、流产、胎儿先天

缺陷和严重肾病，并发感染、代谢改变、糖尿病加重、骨质疏松、组织细胞异常改变。(8) 其他：鞘内注射后可出现惊厥、麻痹症、吉兰－巴雷综合征或脑脊液压力增加。

【用法与用量】(1) 急性白血病：①肌内或静脉注射，一次 10 ~ 30 mg，一周 1 ~ 2 次；②儿童，一次 20 ~ 30 mg/m^2，一周 1 次，或视骨髓情况而定。(2) 绒毛膜上皮癌或恶性葡萄胎：一次 10 ~ 20 mg，可溶于 5% 或 10% 的葡萄糖注射液 500 ml 中静脉滴注，一日 1 次，5 ~ 10 次为 1 个疗程。总量 80 ~ 100 mg。(3) 脑膜白血病：鞘内注射，一次 6 mg/m^2，成人，一次 5 ~ 12 mg，最大不多于 12 mg，一日 1 次，5 日为 1 个疗程。预防用药，一次 10 ~ 15 mg，每隔 6 ~ 8 周一次。(4) 实体瘤：静脉给药，一次 20 mg/m^2；亦可介入治疗。

【制剂与规格】注射用甲氨蝶呤：① 5 mg；② 0.1 g；③ 1 g。

甲氨蝶呤注射液：① 2 ml : 50 mg；② 20 ml : 0.5 g；③ 10 ml : 1 g。

第10章 肿瘤用药

(2) 胸腺核苷合成酶抑制药：氟尿嘧啶是胸腺核苷合成酶抑制药的代表性药物，只特异性作用于 S 期。是消化道癌基本物品以及乳腺癌常用方案组成之一。氟尿嘧啶口服吸收不稳定，多采用静脉，动脉及腔内注射，大剂量用药能透过血脑屏障。黏膜炎是氟尿嘧啶的特征性消化道反应。持续静脉输注 5-FU，将 DNA 合成障碍，而不加重药物的不良反应，目前临床上广泛应用氟尿嘧啶持续静脉输注。卡培他滨为选择性的氟尿嘧啶口服衍生物，通过胸腺嘧啶磷酸化酶（TP）激活，因肿瘤内 TP 酶活性较高。手足综合征是比较特殊的皮肤毒性，另外一种为高胆红素血症。

氟尿嘧啶 [保（甲/乙）]

Fluorouracil

【适应证】用于消化道肿瘤、绒毛膜上皮癌、乳腺癌、卵巢癌、肺癌、宫颈癌、膀胱癌及皮肤癌。

【注意事项】(1) 用药期间应停止哺乳。(2) 除较小剂量做放射增敏剂外，不宜与放疗同用。(3) 有下列情况慎用，如肝功能明显异常，白细胞计数 < 3.5×10^9/L、血小板 < 50×10^9/L 者，感染，出血（包括皮下和胃肠道）或发热超过 38℃者，明显胃肠道梗阻者，脱水或（和）酸碱、电解质平衡失调者。(4) 治疗前及疗程中定期检查周围血象。(5) 用药期间不宜饮酒或同用阿司匹林类药。(6) 不能做鞘内注射。

【禁忌证】对本品过敏者，伴水痘或带状疱疹者，衰弱患者，妊娠初期 3 个月内妇女。

【不良反应】常见恶心、食欲减退、呕吐、白细胞计数减少、脱发、注药静脉上升性色素沉着；偶见口腔黏膜炎或溃疡、腹部不适、腹泻、心肌缺血、心绞痛和心电图的变化；罕见血小板计数减少；极少见咳嗽、气促、小脑共济失调；长期应用可致神经系统毒性；长期动脉插管可引起动脉栓塞或血栓形成、局部感染、脓肿形成或栓塞性静脉炎。

【用法与用量】(1) 静脉注射：一日 10 ~ 20 mg/kg，连续 5 ~ 10 日，1 个疗程 5 ~ 7 g（甚至 10 g）。(2) 静脉滴注：一日 300 ~ 500 mg/m^2，滴注时间不少于 6 ~ 8 小时，可用输液泵连续给药维持 24 小时，连续 3 ~ 5 日。(3) 腹腔内注射，一次 500 ~ 600 mg/m^2，一周 1 次，2 ~ 4 次为 1 个疗程。用于原发性或转移性肝癌、多采用动脉插管注药。

【制剂与规格】氟尿嘧啶注射液：10 ml : 0.25 g。

氟尿嘧啶软膏：① 4 g : 0.02 g；② 4 g : 0.1 g。

尿嘧啶替加氟

Uracil Tegafur

【适应证】用于胃癌、肠癌、胰腺癌、乳腺癌、鼻癌、肺癌和肝癌。

【注意事项】(1) 用药期间定期检查血常规，注意骨髓抑制及胃肠道反应。(2) 肝肾功能障碍者慎用，并酌情减量。(3) 育龄患者必须应用时要考虑药物对性腺的影响。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见血小板和白细胞计

数减少、食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、腹痛、乏力、寒战、发热、头痛、眩晕、共济失调、瘙痒、色素沉着、黏膜炎及注射部位疼痛。

【用法与用量】口服。一次 2 ~ 4 片，一日 3 次。

【制剂与规格】尿嘧啶替加氟片：内含替加氟 50 mg、尿嘧啶 112 mg。

替加氟[保(甲/乙)]

Tegafur

【适应证】用于胃癌、直肠癌、胰腺癌、肝癌和乳腺癌。

【注意事项】(1) 用药期间注意骨髓抑制和胃肠道反应。(2) 肝肾功能障碍者慎用，并酌情减量。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见白细胞计数及血小板下降，头痛、眩晕、共济失调、精神状态改变、恶心、呕吐、腹泻、肝肾功能改变，注射部位可见静脉炎、肿胀和疼痛，偶见发热、皮肤瘙痒、色素沉着等。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一日 0.6 ~ 1.2 g，分 3 ~ 4 次服，总量 20 ~ 40 g 为 1 个疗程；② 儿童，一日 16 ~ 24 mg/kg，分 4 次服用。(2) 静脉滴注：成人，一次 0.8 ~ 1 g，或一次 15 ~ 20 mg/kg，溶于 5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液 500 ml 中，一日 1 次，总量 20 ~ 40 g 为 1 个疗程。可与其他抗肿瘤药联用。

【制剂与规格】替加氟片：① 50 mg；② 100 mg。

替加氟胶囊：① 0.1 g；② 0.2 g。

注射用替加氟：0.2 g。

替加氟注射液：① 5 ml : 0.2 g；② 10 ml : 0.5 g。

替加氟栓：① 0.5 g；② 0.75 g。

替吉奥胶囊[保(乙)]：用于不能切除的局部晚期或转移性胃癌。①每粒含替加氟 20 mg、吉美嘧啶 5.8 mg 与奥替拉西钾 19.6 mg；②每粒含替加氟 25 mg、吉美嘧啶 7.25 mg 与奥替拉西钾 24.5 mg。用法：(1) 单独用药：通常，应按体表面积计算成人首次给药剂量的基准量（1 次剂量），一日 2 次，于早饭后和晚饭后各服 1 次，连服 28 日，之后停药 14 日。此为 1 个周期，可以反复进行。可根据患者的状态适当增减给药量，剂量设置为一次 40、50、60、75 mg。需增加剂量时，若不出现与本品有关的临床检查值（血液学检查、肝肾功能检查）异常及消化道症状，无安全性问题，可按基准量顺次增加一个剂量，但最高不得超过一次 75 mg；减小剂量时，按基准量顺次减小 1 个剂量，最低给药剂量为一次 40 mg。(2) 联合用药：口服替吉奥胶囊一日 80 mg/m^2，一日 2 次，于早饭后和晚饭后各服 1 次，连服 14 日，停药 7 日；顺铂：75 mg/m^2，分 3 日静脉滴注（第 1、2、3 日）。每 3 周为 1 个周期，应至少进行 2 个周期的治疗。

卡莫氟[保(乙)]

Carmofur

【适应证】用于食管癌、胃癌、结肠癌、直肠癌和乳腺癌。

【注意事项】(1) 高龄、骨髓功能低下、肝肾功能不全、营养不良者及妊娠期妇女慎用。(2) 服药后避免摄入乙醇性饮料。(3) 用药期间定期检查白细胞计数和血小板，若出现骨髓抑制应酌情减量或停用。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠初期 3 个月内妇女。

【不良反应】可见白细胞计数减少、血小板减少、步行及意识障碍、锥体外系反应、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、消化道溃疡、肝肾功能异常、胸痛、ECG 异常、皮疹、发热或水肿。

【用法与用量】口服：成人一次 200 mg，一日 3~4 次，或一日 140 mg/m^2，分 3 次服用。联合化疗，一次 200 mg，一日 3 次。

【制剂与规格】卡莫氟片：50 mg。

去氧氟尿苷[保(乙)]

Doxifluridine

【适应证】用于乳腺癌、胃癌、结肠癌、直肠癌和鼻咽癌。

【注意事项】(1) 抗病毒药索立夫定可阻碍本品代谢，故本品忌与其联合应用。(2) 骨髓功能抑制、肝肾功能障碍、并发感染、心脏疾病或既往有心脏病史、消化

道溃疡或出血、水痘、儿童及高龄患者慎用。(3) 定期检查血象、肝肾功能，注意感染症状及出血倾向，可能引起严重的肠炎及脱水。

【禁忌证】对本品过敏者，妊娠及哺乳期妇女，正在接受索立夫定治疗者。

【不良反应】(1) 消化系统：可见腹泻、食欲减退、恶心、呕吐、口腔炎、口干、唇炎、胃炎、腹部不适、腹痛、腹胀、麻痹性肠梗阻、AST 升高；罕见胃肠道出血、胃溃疡、舌炎。(2) 血液系统：可见白细胞计数减少、血红蛋白降低，偶见血小板减少、贫血。(3) 皮肤及软组织：可见脱发、皮疹、湿疹、荨麻疹、色素沉着，罕见光过敏，指趾异常。(4) 中枢神经系统：可见倦怠感、疲乏、头晕、头痛、嗜睡、耳鸣、脚步不稳、定向障碍、听觉障碍、感觉障碍、嗅觉异常、口齿不清、味觉减弱、咽喉部不适、眼睛疲劳、发热。(5) 泌尿系统：可见尿素氮升高、血尿、蛋白尿、尿频。(6) 其他：罕见胸部压迫感、心悸、心电图异常。

【用法与用量】口服：一日 0.8 ~ 1.2g，分 3 ~ 4 次餐后服，6 ~ 8 周为 1 个疗程。

【制剂与规格】去氧氟尿苷片（胶囊）：200 mg。

卡培他滨 [保(乙)]

Capecitabine

【适应证】用于结肠癌辅助化疗及结肠癌、直肠癌、乳腺癌和胃癌。

【注意事项】(1) 注意手足综合征，如果出现 2 或 3 度手足综合征应中断用药，发生 3 度手足综合征后再使用本品剂量应降低。(2) 肾功能不全患者需调整剂量。(3) 与华法林联合应用期间应监测抗凝反应。(4) 与苯妥英钠同用应监测苯妥英钠水平。

【禁忌证】对本品或其任何成分过敏者，对氟尿嘧啶有严重、未预期反应患者或已知对氟尿嘧啶过敏者，二氢嘧啶脱氢酶（DPD）缺陷者，与索立夫定或其同型物（如溴夫定）同用，严重肾功能损害者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 消化系统：可见腹泻、恶心、呕吐、口腔炎、味觉紊乱、食欲减退、腹痛、胃肠动力紊乱、便秘、口腔不适、上消化道炎症性疾病、胃肠道出血、肠梗阻等。(2) 皮肤及软组织：可见手足综合征、皮炎、皮肤脱色、指甲病变、脱发。(3) 中枢神经系统：可见疲乏、虚弱、发热、水肿、疼痛、胸痛、感觉异常、头痛、头晕、失眠、脱水、情绪改变、抑郁、眼部刺激、视觉异常。(4) 呼吸系统：可见呼吸困难、咳嗽、咽痛、鼻出血、咽喉痛。(5) 血液系统：可见中性粒细胞减少、血小板减少、贫血、高胆红素血症。(6) 其他：可见静脉栓塞、背痛、关节痛、水肿、感染或梅毒。

【用法与用量】口服：一次 1.25 g/m^2，一日 2 次。治疗 2 周后间隔 1 周，3 周为 1 个疗程。餐后 30 分钟内用水吞服。根据毒性反应和肝肾功能情况做剂量调整。

【制剂与规格】卡培他滨片：① 0.15 g；② 0.5 g。

(3) 嘌呤核苷合成酶抑制药：嘌呤核苷合成酶抑制药中，巯嘌呤用于急性白血病的维持治疗，巯鸟嘌呤口服给药，用于缓和急性髓性白血病。阿糖胞苷主要用于治疗急性髓性白血病。阿糖胞苷可导致重度骨髓抑制，需要密切监测血常规。

巯嘌呤 [保(乙)]

Mercaptopurine

【适应证】用于绒毛膜上皮癌、恶性葡萄胎、急性淋巴细胞白血病及急性非淋巴细胞白血病及慢性粒细胞白血病的急变期。

【注意事项】(1) 老年白血病患者确须服用本品时，需加强支持疗法，并严密观察症状、体征及周围血象等动态改变，及时调整剂量。(2) 对诊断的干扰。白血病时有大量白血病细胞破坏，在服用本品时则破坏更多，致使血及尿中尿酸浓度明显增高，严重者可产生尿酸性肾结石。(3) 下列情况应慎用，如骨髓已有显著的抑制现象，血象表现有白细胞计数减少或血小板显著降低，并出现相应的严重感染或明显的出血倾向，有肝肾功能损害，胆道疾病者，痛风病史者，尿酸盐肾结石病史者，4 ~ 6 周接受过细胞毒药物或放射

治疗者。(4) 定期检查外周血象及肝肾功能，对血细胞在短期内急剧下降者，应一日观察血象。

【禁忌证】妊娠初期 3 个月内妇女。

【不良反应】较常见骨髓抑制、白细胞计数及血小板减少、肝脏损害；并可致胆汁淤积，出现黄疸、恶心、呕吐、食欲减退、口腔炎、腹泻、高尿酸血症、尿酸性肾病；少见间质性肺炎及肺纤维化。

【用法与用量】口服：①成人。用于绒毛膜上皮癌，一日 6 ~ 6.5 mg/kg，分 2 次口服，10 日为 1 个疗程，疗程间歇为 3 ~ 4 周。用于白血病，开始一日 2.5 mg/kg，或 80 ~ 100 mg/m^2，一日 1 次或分次服用，一般于用药后 2 ~ 4 周可显效，如用药 4 周后，仍未见临床改进及白细胞计数下降，则可考虑在仔细观察下，加量至一日 5 mg/kg；维持量，一日 1.5 ~ 2.5 mg/kg，或 50 ~ 100 mg/m^2，一日 1 次或分次服用。②儿童。一日 1.5 ~ 2.5 mg/kg 或 50 mg/m^2，一日 1 次或分次服用。

【制剂与规格】巯嘌呤片：50 mg。

硫鸟嘌呤[保(乙)]

Tioguanine

【适应证】用于急性淋巴细胞性白血病及急性非淋巴细胞性白血病的诱导缓解期及继续治疗期，慢性粒细胞性白血病的慢性期及急变期。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女慎用。(2) 老年患者耐受性较差，用药时需加强支持疗法。(3) 明显骨髓抑制、肝肾损害、胆道疾患者、痛风病史、尿酸盐结石病史、4 ~ 6 周接受过细胞毒药物或放疗者慎用。(4) 注意检查周围血象和肝肾功能。

【禁忌证】妊娠初期 3 个月内的妇女。

【不良反应】可见骨髓抑制、白细胞计数减少、血小板减少、恶心、呕吐、食欲减退、肝功能损害、黄疸、高尿酸血症、尿酸性肾病、睾丸或卵巢功能抑制、闭经或精子缺乏。

【用法与用量】口服：①成人。初始一日 2 mg/kg 或一日 100 mg/m^2，一日 1 次或分次服用，如 4 周后临床未见改进，白细胞计数未见抑制，可慎将剂量增至一日 3 mg/kg。维持量，一日 2 ~ 3 mg/kg 或一日 100 mg/m^2。②儿童。一日 2.5 mg/kg，分 1 ~ 2 次服。

【制剂与规格】硫鸟嘌呤片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

(4) 核苷酸还原酶抑制药

羟基脲[保(甲)]

Hydroxycarbamide

【适应证】用于慢性粒细胞白血病、黑色素瘤、肾癌、头颈部癌，联合放疗治疗头颈部及宫颈鳞癌。

【注意事项】(1) 本品可抑制免疫功能，用药期间避免接种病毒疫苗。(2) 服用本品时应适当增加液体的摄入量，以增加尿量及尿酸的排泄。(3) 定期监测白细胞计数、血小板、血中尿素氮、尿酸及肌酐浓度。(4) 老年患者应适当减少剂量。(5) 下列情况应慎用，如严重贫血未纠正前，骨髓抑制，肾功能不全，痛风，尿酸盐结石史等。

【禁忌证】水痘、带状疱疹及各种严重感染者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见骨髓抑制、白细胞计数和血小板减少、胃肠道反应、睾丸萎缩和畸胎，中枢神经系统症状有脱发、药物性发热。

【用量与用量】口服。常规用药 CML，一日 20 ~ 60 mg/kg，一周 2 次，连续 6 周为 1 个疗程。

头颈癌、宫颈鳞癌等一次 80 mg/kg，间隔 3 日 1 次，需与放疗合用。

【制剂与规格】羟基脲片：0.5 g。

(5) DNA 多聚酶抑制药：DNA 多聚酶抑制药有氟达拉滨、克拉屈滨等。氟达拉滨用于治疗 B 细胞性慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 患者，氟达拉滨可导致骨髓抑制，并可能累积。对于慢性白血病及低度恶性淋巴瘤，巨球蛋白血症，蕈样真菌病，霍奇金病以外的其他实体癌无效。氟达拉滨 + 利妥昔单抗，氟达拉滨联合米托蒽醌及地塞米松 + 利妥昔单抗用于滤泡性淋巴瘤的一线治疗。克拉屈滨通过静脉输注或者皮下注射用于治疗毛细胞白血病，也可用于治疗慢淋，低度恶性淋巴瘤及皮肤淋巴瘤。

目前临床应用愈来愈多的药物吉西他滨，静脉注射后在细胞内经过核苷激酶的作用转化成具有活性的二磷酸（dFdCDP）及三磷酸（dFdCTP），dFdCDP 抑制核苷酸还原酶的活性，使合成 DNA 必需的三磷酸脱氧核苷产生抑制。

吉西他滨用于非小细胞肺癌、晚期膀胱癌，局部晚期或转移性胰腺癌。NCCN（2007，中国版）推荐，吉西他滨联合紫杉醇用于治疗转移性乳腺腺癌。

阿糖胞苷[保（甲）]

Cytarabine

【适应证】用于急性非淋巴细胞性白血病的诱导缓解和维持治疗，急性淋巴细胞性白血病，慢性髓细胞性白血病（急变期），联合用药治疗儿童非霍奇金淋巴瘤。单独或与其他药物联合治疗高危白血病，难治性和复发性急性白血病，鞘内应用可预防或治疗脑膜白血病。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 本品可引起 ALT、血及尿中尿酸量增高。(3) 骨髓抑制、白细胞计数及血小板显著减低、肝肾功能不全、胆道疾病者、痛风病史、尿酸盐肾结石病史、近期接受过细胞毒药物或放疗者慎用。(4) 用药期间定期检查，如周围血象、血细胞和血小板计数、骨髓涂片、肝肾功能。(5) 应用本品时宜适当增加患者的液体摄入量，使尿液保持碱性。(6) 鞘内注射不用含苯甲醇的稀释液，可用不含防腐剂的氯化钠注射液配置并立即使用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 血液系统：常见贫血、白细胞计数减少、血小板减少、巨幼红细胞增多和网状红细胞减少。(2) 消化系统：常见厌食、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、肝功能异常、黄疸、食管溃疡、严重的胃肠道溃疡、小肠积气囊肿所致的腹膜炎、肝脓肿、肝脏损害伴高胆红素血症、肠坏死和坏死性结肠炎、口腔或肛周炎症或溃疡。(3) 泌尿系统：可见尿潴留、肾功能不全。(4) 中枢神经系统：可见神经炎、眩晕、咽痛、胸痛、发热、头痛。(5) 呼吸系统：可见肺炎、呼吸困难。(6) 皮肤及软组织：可见皮疹、血栓性静脉炎，少见脓毒血症、荨麻疹、雀斑、结膜炎、脱发、过敏、瘙痒。大剂量治疗时，可能出现可逆性的角膜毒性和出血性结膜炎，大、小脑功能失调、性格改变、嗜睡和昏迷、神经病变、心肌病变、肺水肿、脱发、高尿酸血症、尿酸性肾病；注射部位可见蜂窝织炎和皮肤溃疡。另外，本品综合征通常发生于用药后 6 ~ 12 小时，主要表现为发热、肌痛、骨痛、偶尔胸痛、斑丘疹、咽痛、结膜炎和全身不适。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注。(1) 成人：①诱导缓解。低剂量化疗，一日 200 mg/m^2，持续输人 5 日（120 小时），总剂量 1 g/m^2，2 周重复 1 次，需要根据血象反应做调整。高剂量化疗，一次 2 g/m^2，12 小时 1 次，输入时间 >3 小时，第 1 ~ 6 日给药，即 12 次；或者一次 3 g/m^2，12 小时 1 次，输入时间 >1 小时，第 1 ~ 6 日给药，即 12 次；或者一次 3 g/m^2，12 小时 1 次，输入时间 >75 分钟，第 1 ~ 6 日给药，即 12 次。联合化疗，一日 100 mg/m^2，持续静脉注射，第 1 ~ 7 日给药。②用于巩固治疗，对诱导方案做适当调整，疗程间歇时间较诱导阶段延长。(2) 儿童：诱导及巩固治疗可参照成人剂量计算，可根据儿童年龄、体重、体表面积等因素做相应调整。脑膜白血病的鞘内应用，一次 5 ~ 75 mg/m^2，一日 1 次，连续 4 日或每隔 4 日 1 次。最常用方法是 30 mg/m^2，4 日一次，直至脑脊液检查正常，再给予 1 个疗程治疗。本品鞘内注射作为防治脑膜白血病的第二线药物，联用地塞米松 5 mg，如为预防性则每 4 ~ 8 周 1 次。

【制剂与规格】注射用阿糖胞苷：① 50 mg；② 0.1 g；③ 0.5 g。

阿糖胞苷注射液：① 1 ml : 0.1 g；② 5 ml : 0.5 g；③ 10 ml : 1.0 g。

吉西他滨[保（乙）]

Gemcitabine

【适应证】用于局部晚期或已转移的非小细胞肺癌、局部晚期或已转移的胰腺癌。

【注意事项】(1) 骨髓功能受损的患者慎用，联合用药时注意骨髓毒性。证实

有骨髓抑制时，应暂停化疗或者修改治疗方案。(2) 肝功能不全的患者慎用。已经出现肝脏转移或既往有肝炎、酗酒或肝硬化病史的患者应用本品可能会使潜在的肝功能不全恶化。(3) 肾功能不全时应定期进行实验室检查。(4) 若有微血管病性溶血性贫血的表现应立即停药。(5) 定期进行血液学、肝肾功能检查。(6) 用药期间禁止驾驶和操作机器。(7) 推荐氯化钠注射液为唯一溶剂，避免与其他药物混合配置，稀释后药物浓度不超过 40 mg/ml。

【禁忌证】对本品高度过敏者、联用放疗、严重肾功能不全的患者联用顺铂患者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见贫血、白细胞计数降低、血小板减少、中性粒细胞减少、周围性血管炎。(2) 消化系统：可见 ALT 及 AST 升高、碱性磷酸酶升高、厌食、恶心、呕吐、腹泻、口腔黏膜炎。(3) 呼吸系统：可见咳嗽、鼻炎、呼吸困难、支气管痉挛、肺水肿、间质性肺炎、成人呼吸窘迫综合征及流感样症状。(4) 泌尿系统：可见轻度蛋白尿、血尿。(5) 循环系统：可见低血压、心肌梗死、充血性心力衰竭、心律失常、水肿。(6) 中枢神经系统：可见发热、头痛、背痛、寒战、肌痛、疲乏、全身不适、出汗、失眠、局部疼痛、嗜睡。(7) 皮肤及软组织：可见脱发、皮疹、瘙痒、脱皮、水疱和皮肤溃疡。

【用法与用量】严格静脉给药：成人。(1) 用于非小细胞肺癌：①单药，一次 1 g/m^2，滴注 30 分钟，一周 1 次，连续 3 周间隔 1 周，4 周重复 1 次；②联合用药（联合顺铂）3 周疗法，一次 1.25 g/m^2，滴注 30 分钟，第 1、8 日给药，间隔 1 周；4 周疗法，一次 1 g/m^2，滴注 30 分钟，第 1、8、15 日给药，间隔 1 周。(2) 用于晚期胰腺癌：一次 1 g/m^2，滴注 30 分钟，一周 1 次，连续 7 周间隔 1 周，以后一周 1 次，连续 3 周间隔 1 周。

【制剂与规格】注射用盐酸吉西他滨：① 0.2 g；② 1 g。

培美曲塞二钠

Pemetrexed Disodium

【适应证】恶性胸膜间皮瘤，以及经含有顺铂方案化疗后失败的晚期非小细胞肺癌。

【注意事项】本品主要通过尿路以原药形式排出体外。如果患者肌酐清除率每分钟 ≥ 45 ml，本品无需剂量调整。对于肌酐清除率每分钟 < 45 ml 的患者，无足够患者的研究资料来给予推荐剂量。因此，对于肌酐清除率每分钟 < 45 ml 的患者，不应给予本品治疗。接受本品治疗同时应接受叶酸和维生素 B_{12} 的补充治疗，可以预防或减少治疗相关的血液或胃肠道不良反应，降低总的不良反应发生率，包括 3/4 度的血液学毒性以及非血液学毒性，例如中性粒细胞减少、粒细胞减少性发热和 3/4 度粒细胞减少性感染。给药前未给予类皮质激素预处理的患者易出现皮疹。地塞米松预处理可以降低皮肤反应的发生率及严重程度。老年用药可按照所有患者的剂量调整方法进行，无需特殊方案。本品不推荐儿童应用。儿童用药的安全性和有效性尚未确定。建议佩戴手套。如果本品注射液接触到皮肤，立即用肥皂和水彻底清洗。如果本品注射液接触到黏膜，用水彻底清洗。处置抗癌药目前没有统一的推荐标准。

【禁忌证】培美曲塞或药品其他成分有严重过敏史的患者；妊娠、哺乳期妇女。

【不良反应】发生率较高的不良反应有：骨髓抑制、胃肠道反应、转氨酶升高、疲劳、皮疹等。发生率为 1% ~ 5%（包括 5%）的临床相关的毒性反应包括：神经障碍、运动神经元病、腹痛、肌酐升高、中性粒细胞减少性发热、无中性粒细胞减少性感染、变态反应/过敏和多型性红斑；发生率 ≤ 1% 的临床相关的毒性反应包括室上性心率失常。

【用法与用量】每 21 日 500 mg/m^2。每支 500 mg 药品用 20 ml 0.9% 的氯化钠注射液（不含防腐剂）溶解成浓度为 25 mg/ml 的本品溶液，慢慢旋转直至粉末完全溶解。完全溶解成的溶液澄清，颜色为无色至黄色或黄绿色都是正常的。本品溶解的 pH 为 6.6 ~ 7.8，且溶液需要进一步稀释。静脉滴注前观察药液有无沉淀及颜色变化；如果有异样，不能滴注。本品溶液配好后应用 0.9% 氯化钠注射液

（不含防腐剂）稀释至100 ml，静脉滴注超过10分钟。未预服皮质类固醇药物的患者，应用本品皮疹发生率较高。预服地塞米松可以降低皮肤反应的发生率及其严重程度。给药方法：地塞米松4 mg口服一日2次，本品给药前1日、给药当日和给药后1日连服3日。为了减少毒性反应，本品治疗必须同时服用低剂量叶酸或其他含有叶酸的复合维生素制剂。服用时间：第一次给予本品治疗开始前7日至少服用5次日剂量的叶酸，一直服用整个治疗周期，在最后1次本品给药物21日可停服。患者还需在第一次本品给药前7日内肌内注射维生素 B_{12} 一次，以后第3个周期肌内注射一次，以后的维生素 B_{12} 给药可与本品用药在同一日进行。叶酸给药剂量：350～1 000 μg，常用剂量是400 μg；维生素 B_{12} 剂量1 000 μg。

【制剂与规格】注射用培美曲塞二钠：500 mg/瓶。

氟达拉滨[保(乙)]

Fludarabine

【适应证】B细胞性慢性淋巴细胞白血病（CLL），这些患者接受过至少一个标准的含烷化剂方案的治疗，且在治疗期间或其后病情没有改善或仍持续进展。

【注意事项】(1) 注意本品引起的神经毒性、骨髓抑制、输血相关的移植物抗宿主病、疾病进展及转化、既往的皮肤癌病变加重、肿瘤溶解综合征、自身免疫现象、肾功能减低。(2) 健康状况差的患者，如严重骨髓功能障碍、免疫缺陷或有机会性感染病史的患者慎用。(3) 有生育能力的男性或女性在治疗期间及治疗后6个月须采取避孕措施。(4) 儿童和＞75岁的老年人慎用。(5) 治疗期间或治疗后避免接种活疫苗。(6) 再次使用本品单一疗法很可能对初次使用其治疗有效的患者仍然有效，对本品耐药的患者对苯丁酸氮芥也可表现出耐药。(7) 接受本品治疗的患者需要输血时只能使用被照射过的血液。

【禁忌证】对本品或其所含成分过敏者，肌酐清除率每分钟＜30 ml的肾功能不全者，失代偿性溶血性贫血者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见骨髓抑制、白细胞计数和血小板减少、贫血、肺炎、咳嗽、发热、疲倦、虚弱、恶心、呕吐、腹泻、胃肠道出血、食欲减退、黏膜炎、口腔炎、ALT及AST异常、寒战、水肿、全身不适、周围神经病变、意识模糊、视力障碍、皮疹和严重的机会性感染。

【用法与用量】(1) 静脉注射：成人，一日25 mg/m^2，连续5日，28日为1个周期，每个小瓶用2 ml注射用水配制成25 mg/ml的溶液，将所需剂量抽入注射器内；如果静脉注射，需再用0.9%氯化钠注射液10 ml稀释；如果静脉输注，需再用0.9%氯化钠注射液100 ml稀释，输注时间30分钟。(2) 口服：一次40 mg/m^2，一日1次，连续5日，28日为1个周期，须以水吞服。

【制剂与规格】磷酸氟达拉滨片：10 mg。

注射用磷酸氟达拉滨：50 mg。

10.3.1.3 作用于核酸转录的药物

作用于核酸转录的药物包括放线菌素D、阿柔比星（见前述）和吡柔比星（见前述），均是由微生物产生的具有抗肿瘤作用的化学物质。这三种药物均为细胞周期非特异性药物，对处于各个细胞周期时相的肿瘤细胞均有杀伤作用。这三种药物的适应证不同。放线菌素D对绒毛膜细胞癌的疗效突出，对儿童肾母细胞瘤、尤因肉瘤、横纹肌肉瘤、睾丸肿瘤和淋巴瘤也有较好的疗效。

放线菌素D[保(甲)]

Dactinomycin

【适应证】用于霍奇金病、神经母细胞瘤、绒癌、睾丸癌，联合放疗治疗儿童肾母细胞瘤，尤因肉瘤及横纹肌肉瘤。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女、1岁以下幼儿、骨髓功能低下者、有出血倾向者、痛风病史、肝功能损害、感染、尿酸盐性肾结石病史、近期接受过放疗或化疗者慎用。(2) 可使尿及血中尿酸增加干扰诊断。(3) 定期检查周围血象及肝肾功能。(4) 外漏时，立即用1%普鲁卡因注射液局部封闭，或用50～100 mg氢化可的松

局部注射及冷湿敷。

【禁忌证】有患水痘病史者，妊娠期妇女。

【不良反应】常见白细胞计数减少、血小板减少、厌食、恶心、呕吐、腹泻、口腔溃疡、胃炎、肠炎、肝功能不全、脱发、皮肤红斑、脱屑、色素沉着、免疫抑制、致畸、闭经或精子缺乏。药液外漏可致疼痛、静脉炎、局部硬结及溃疡。

【用法与用量】静脉注射：①成人。一次 0.3 ~ 0.4 mg（6 ~ 8 μg/kg），溶于氯化钠注射液 20 ~ 40 ml，一日 1 次，10 日为 1 个疗程，间歇期 2 周，1 个疗程总量 4 ~ 6 mg。②儿童，一日 0.45 mg/m^2，连续 5 日，3 ~ 6 周为 1 个疗程。

【制剂与规格】注射用放线菌素 D：0.2 mg。

阿柔比星[保(乙)]

Aclarubicin

【适应证】用于急性白血病、恶性淋巴瘤、肺癌及卵巢癌。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如肝、肾功能受损者、老年患者、水痘患者、儿童，用过多柔比星、柔红霉素的患者。(2) 在用药期间，应定期检查血象、肝、肾、心功能。(3) 用药期间出现合并严重感染、发热或出血倾向、心力衰竭或心电图异常、胃肠道出血的患者应考虑停药。药液溶解后及时用完，静脉注射、静脉滴注药物避免漏出血管外。(4) 为防止静脉炎，采用静脉滴注方式较好。

【禁忌证】过敏史患者，有心功能异常及心脏病史者禁用。妊娠及哺乳期妇女慎用或禁用。

【不良反应】(1) 循环系统：可见心电图异常、心动过速、心律失常、心力衰竭，与多柔比星的毒性大致相同，但心肌毒性比多柔比星小 1/10，对心脏的损伤较轻。(2) 消化系统：可见食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、肝功能损伤，偶见 ALT 及 AST 升高，也可合并消化道出血、口腔炎等。(3) 血液系统：可见红细胞及白细胞计数减少、血小板减少、出血倾向、贫血。(4) 中枢神经系统：可见头痛、倦怠、乏力、发热等。(5) 泌尿系统：可致肾功能损伤、膀胱炎。(6) 其他：见皮疹、色素沉着、脱发。

【用法与用量】静脉滴注：①用于急性白血病，一次 0.4 mg/kg，一日 1 次，10 ~ 15 日为 1 个疗程。②用于恶性淋巴瘤实体瘤，一日 1 次，一次 0.4 mg/kg，7 日为 1 个疗程。也可采用一次 0.8 ~ 1 mg/kg，一周 2 次。

【制剂与规格】注射用盐酸阿柔比星：① 10 mg；② 20 mg。

10.3.1.4 拓扑异构酶抑制药

拓扑异构酶抑制药包括：拓扑异构酶Ⅰ抑制药和拓扑异构酶Ⅱ抑制药。拓扑异构酶Ⅰ抑制药的代表性药物有伊立替康、鲁比特康、羟喜树碱。拓扑异构酶Ⅱ抑制药的代表性药物有依托泊苷、替尼泊苷。

研究表明，多种肿瘤细胞，特别是结肠癌、宫颈癌、卵巢癌等细胞内的拓扑异构酶Ⅰ含量大大高于正常组织，尤其在 S 期肿瘤细胞中活性大幅度提高。

伊立替康（Irinotecan）是一种水溶性的喜树碱类药物。在体内经肝酶 CYP 依赖性脂酶代谢成为有活性的 10- 羟基衍生物 SN-38。除用于结直肠癌、非小细胞肺癌、小细胞肺癌、宫颈癌和卵巢癌等的治疗外，对其他肿瘤，如乳腺癌、恶性神经胶质瘤和胃癌也有一定效果。伊立替康的不良反应多数为轻度、一过性的，严重者可给予阿托品缓解，预防性给予阿托品可降低其发病率。

拓扑替康临床用于治疗乳腺、肺、卵巢癌。不良反应有白细胞计数减少、血小板减少、贫血、恶心、呕吐、腹泻、便秘、肠梗阻、腹痛、口腔炎、厌食、脱发、头痛、关节痛、肌肉痛、全身痛、感觉异常、肝功能异常，ALT 及 AST 升高。静脉注射时，若药液漏在血管外局部可产生局部刺激、红肿。妊娠及哺乳期妇女禁用。

依托泊苷主要用于治疗急性粒细胞白血病、小细胞未分化型肺癌、恶性淋巴瘤、睾丸恶性生殖细胞瘤。替尼泊苷主要用于神经母细胞瘤、绒癌和卵巢癌、急性白血病、恶性淋巴瘤、霍奇金病、小细胞肺癌、卵巢癌、睾丸癌、膀胱癌、网状细胞肉瘤、淋巴细胞肉瘤、儿童神经母细胞瘤等。

依托泊苷在静脉注射时，药液不可外漏，静滴时速度不得过快，至少 30 分钟，否则易引起低血压。不能做胸腔、腹腔和鞘内注射。替尼泊苷、苯巴比妥和苯妥英钠可增加替尼泊苷的清除，合并用药时可能会增加替尼泊苷的剂量。甲苯磺丁脲、水杨酸钠和磺胺甲噻二唑降低替尼泊苷的与蛋白结合率，导致游离药物增加，增加药物作用和毒性反应。

伊立替康[保(乙)]

Irinotecan

【适应证】用于晚期大肠癌，可与 5-FU、CF 联合用，单独用药 5-FU 化疗方案失败者。

【注意事项】(1) 本品应在有经验的肿瘤专科医师的指导下使用。(2) 考虑到不良反应的性质及发生率，对以下患者应在充分权衡治疗带来的好处及可能发生的危险后再选用本品：①患者具危险因素，特别是 WHO 行为状态评分 =2。②在一些罕见的情况下，患者被认为不愿遵守有关不良反应处理措施的忠告时（当迟发性腹泻一旦发生，需立即和持续给予大量液体及抗腹泻治疗），建议医院对这类患者严格管理。(3) 本品不能静脉注射，静脉滴注时间亦不得少于 30 分钟或超过 90 分钟。(4) 关于迟发性腹泻：患者必须了解，在使用本品 24 小时后及在下周期化疗前任何时间均有发生迟发性腹泻的危险。静脉滴注本品后发生首次稀便的中位时间是第 5 日，一旦发生应马上通知医生并立即开始适当的治疗。既往接受过腹部 / 盆腔放射的患者基础白细胞计数升高及行为状态评分 > 2 的患者，其腹泻的危险性增加在治疗不当，腹泻可能危及生命，尤其对于合并中性粒细胞减少症的患者更是如此。一旦出现第一次稀便，患者需开始饮用大量含电解质的饮料并马上开始抗腹泻治疗。这种抗腹泻治疗应由使用本品的单位来进行。出院的患者应携带一定数量的药物以便腹泻发生时及时治疗。另外，当腹泻发生时，患者应及时就诊。目前，推荐的抗腹泻治疗措施为：高剂量的洛哌丁胺（每 2 小时 2 mg 首剂加倍）这种治疗需持续到最后一次稀便结束后 12 小时，中途不得更改剂量，本品有导致麻痹性肠梗阻的危险。故所有患者以此剂量用药一方面不得少于 12 小时，但也不得连续使用超过 48 小时。除抗腹泻治疗外，当腹泻合并严重的中性粒细胞减少症（粒细胞计数 $< 0.5 \times 10^9/L$）时，应用广谱抗生素预防性治疗。除抗腹泻治疗外，当出现以下症状时应住院治疗腹泻，如腹泻同时伴有发热；严重腹泻（需静脉补液）；开始高剂量的洛哌丁胺治疗 48 小时后仍有腹泻发生。洛哌丁胺不应用于预防性治疗，甚至前一周期出现过迟发性腹泻的患者也不应如此。出现严重腹泻的患者，在下个周期用药应减量。(5) 血液学：在本品治疗期间，每周应查全血细胞计数，患者应了解中性粒细胞减少的危险性及发热的意义，发热性中性粒细胞减少症（体温超过 38℃，中性粒细胞计数 $< 0.1 \times 10^9/L$），应立即住院静脉滴注广谱抗生素治疗。只有当中性粒细胞计数 $< 0.15 \times 10^9/L$，方可恢复使用本品治疗。当患者出现严重无症状的中性粒细胞减少症（$< 0.05 \times 10^9/L$），发热（体温超过 38℃）或感染伴中性粒细胞减少（中性粒细胞计数 $< 0.1 \times 10^9/L$），应减量，对出现严重腹泻的患者，因其感染的危险性及血液学毒性会增加，应做全血细胞计数。(6) 老年人由于各项生理功能的减退概率很大，尤其是肝功能减退，因此对老年患者选择本品剂量时应谨慎。(7) 治疗前及每周期化疗前均应检查肝功能。肝功能不良患者（胆红素在正常值上限的 1.0 ~ 1.5，氨基转移酶超过正常值上限的 5 倍时）出现严重中性粒细胞减少症及发热性中性粒细胞减少症的危险性很大，应严密监测。本品禁用于胆红素超过正常值上限 1.5 倍的患者。(8) 一次用药前应预防性使用止吐药。本品引起恶心呕吐的报道很常见。呕吐合并迟发性腹泻的患者应尽快住院治疗。(9) 若出现急性胆碱能综合征（早发性腹泻及其他不同症状如出汗、腹部痉挛、流泪、瞳孔缩小及流涎），应使用硫酸阿托品治疗（0.25 mg 皮下注射）。对气喘的患者应小心谨慎。对有急性、严重的胆碱能综合征患者，下次使用本品时，应预防性使用硫酸阿托品。(10) 治疗期间及治疗结束后

3个月应采取避孕措施。(11) 对驾驶和操作机器能力的影响：患者应注意，在使用本品24小时内。有可能出现头晕及视力障碍，因此建议当这些症状出现时请勿驾车或操作机器。

【禁忌证】对盐酸伊立替康三水合物或其辅料过敏者；慢性肠炎和（或）肠梗阻；胆红素超过正常值上限1.5倍；严重骨髓功能衰竭者；WHO行为状态评分>2；妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 迟发性腹泻和中性粒细胞减少为剂量限制性毒性，迟发性腹泻多发生在给药后5日，平均持续4日，严重者致死。(2) 消化系统：可见伪膜性肠炎、恶心、呕吐，肠梗阻、肠绞痛、胃肠道出血、大肠炎、肠穿孔、厌食、腹痛及黏膜炎。(3) 血液系统：可见中性粒细胞减少、血小板下降、贫血、乙酰胆碱综合征。于用药后24小时内可出现腹痛、黏膜炎、鼻炎、低血压、血管舒张、出汗、寒战、全身不适、头晕、视力障碍、瞳孔缩小、流泪及流涎、乏力、发热、气短、呼吸困难、脱发、皮肤反应、过敏反应、肌肉收缩、痉挛、感觉异常、短暂性语言障碍。

【用法与用量】仅用于成人。本品推荐剂量为350 mg/m^2，静脉滴注30～90分钟，3周1次。(1) 剂量调整：对于无症状的严重中性粒细胞减少症（中性粒细胞计数<0.05×10^9/L），中性粒细胞减少伴发热或感染（体温超过38℃），中性粒细胞计数<0.1×10^9/L，或严重腹泻（需静脉输液治疗）的患者，下周期治疗剂量应从350 mg/m^{2}减至300 mg/m^2，若这一剂量仍出现严重中性粒细胞减少症，或如上所述的与中性粒细胞减少相关的发热及感染或严重腹泻时，下一周期治疗剂量可进一步从300 mg/m^{2}减量至250 mg/m^2。(2) 延迟给药：患者中性粒细胞计数未恢复至1 500/mm^{3}以上前请勿使用本品。当患者曾出现过严重中性粒细胞减少症或严重胃肠道的不良反应如腹泻、恶心和呕吐时，本品的使用必须推迟到这些症状，尤其是腹泻完全消失为止。(3) 疗程：本品应持续使用直到出现客观的病变进展或难以承受的毒性时停药。(4) 特殊人群：肝功能受损的患者，当患者的胆红素在正常值上限的1.0～1.5倍时，发生重度中性粒细胞减少症的可能性增加，对该人群应经常进行全血细胞计数。当患者的胆红素超过正常值上限的1.5倍时，不可用本品治疗。(5) 肾功能受损的患者：本品不宜用于肾功能不良的患者。(6) 老年人：未对老年人进行过特殊药动学研究。但是，由于老年人各项生理功能，尤其是肝功能的减退概率很大，选择剂量时须谨慎。

【制剂与规格】注射用盐酸伊立替康：40 mg。

盐酸伊立替康注射液：① 2 ml∶40 mg；② 5 ml∶0.1 g。

羟喜树碱

Hydroxycamptothecin

【适应证】用于原发性肝癌、胃癌、膀胱癌、直肠癌、头颈部上皮癌及白血病。

【注意事项】(1) 用药期间严格检查血象。(2) 妊娠期妇女慎用。(3) 静脉给药时外渗会引起局部疼痛及炎症。(4) 仅限于用氯化钠注射液稀释，不宜用葡萄糖等酸性溶液溶解和稀释。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】可见恶心、呕吐、食欲减退、骨髓抑制、尿急、尿痛、血尿、蛋白尿及脱发。

【用法与用量】(1) 用于原发性肝癌：①静脉注射，一日4～6 mg，用0.9%氯化钠注射液20 ml溶解后，缓慢注射。②肝动脉给药，一次4 mg，加0.9%氯化钠注射液10 ml灌注，一日1次，15～30日为1个疗程。(2) 用于胃癌：静脉注射，一日4～6 mg，用0.9%氯化钠注射液20 ml溶解后，缓慢注射。(3) 用于膀胱癌：膀胱灌注后加高频透热100分钟，剂量由10 mg逐渐增加至20 mg，一周2次，10～15次为1个疗程。(4) 用于直肠癌：经肠系膜下动脉插管，一次6～8 mg，加入0.9%氯化钠注射液500 ml动脉注入，一日1次，15～20次为1个疗程。(5) 用于头颈部上皮癌：静脉注射，一日4～6 mg，用0.9%氯化钠注射液20 ml溶解后，缓慢注射。(6) 用于白血病：成人，一日6～8 mg/m^2，加入

0.9%氯化钠注射液中静脉滴注，连续30日为1个疗程。

【制剂与规格】羟喜树碱注射液：① 2 ml : 2 mg；② 5 ml : 10 mg。

注射用羟喜树碱：① 2 mg；② 5 mg；③ 10 mg。

拓扑替康[保(乙)]

Topotecan

【适应证】用于小细胞肺癌，一线化疗失败的晚期转移性卵巢癌。

【注意事项】(1) 须在有经验的医师观察下使用，对可能出现的并发症须有明确的诊断和适当处理的设施与条件。(2) 治疗期间须监测外周血象，观察患者有无感染、出血倾向，如有异常应减量或停药。(3) 本品在避光包装内20 ~ 25℃时保持稳定，开瓶后应立即使用。

【禁忌证】对喜树碱类药物或其任何成分过敏者，重度骨髓抑制，中性粒细胞< 0.15×10^9/L者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见白细胞计数减少、血小板减少、贫血、骨髓抑制、恶心、呕吐、胃炎、腹泻、便秘、肠梗阻、腹痛、口腔炎、厌食、脱发、皮炎、瘙痒、胸痛、头痛、关节痛、肌肉痛、全身痛、感觉异常、呼吸困难、肝功能异常、ALT及AST升高、血胆红素升高、疲乏、全身不适、发热、局部刺激、红肿及血管神经性水肿。

【用法与用量】静脉滴注：一次1.2 mg/m^2，一日1次，滴注30分钟，连续5日，21日为1个疗程。

【制剂与规格】注射用盐酸拓扑替康：① 1 mg；② 2 mg。

依托泊苷[保(甲/乙)]

Etoposide

【适应证】用于小细胞肺癌、恶性淋巴瘤、恶性生殖细胞瘤、白血病、神经母细胞瘤、横纹肌肉瘤、卵巢癌、非小细胞肺癌、胃癌及食管癌。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女慎用。(2) 定期检查周围血象和肝肾功能。(3) 不宜静脉注射，静脉滴注速度不得过快，至少30分钟。(4) 不得做胸腔、腹腔和鞘内注射。

【禁忌证】骨髓抑制，白细胞计数、血小板明显低下者，心、肝肾功能严重障碍者，妊娠期妇女；本品含苯甲醇，禁用于儿童肌内注射。

【不良反应】可见骨髓抑制、白细胞计数及血小板减少、食欲减退、恶心、呕吐、口腔炎、脱发、低血压及喉痉挛。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：用氯化钠注射液稀释，浓度不超过0.25 mg/ml。① 成人。一日60 ~ 100 mg/m^2，连续3 ~ 5日，3 ~ 4周为1个疗程。② 儿童。一日100 ~ 150 mg/m^2，连续3 ~ 4日。(2) 口服：一日70 ~ 100 mg/m^2，连续5日，或30 mg/m^2，连续10 ~ 14日，3 ~ 4周为1个疗程。

【制剂与规格】依托泊苷胶囊：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

依托泊苷注射液：5 ml : 0.1 g。

替尼泊苷[保(乙)]

Teniposide

【适应证】用于恶性淋巴瘤、霍奇金病、急性淋巴细胞性白血病、成人与儿童的高危患者、胶质母细胞瘤、空管膜瘤、星形细胞瘤、膀胱癌、神经母细胞瘤和儿童的其他实体瘤。

【注意事项】(1) 肝肾功能异常或肿瘤已侵犯骨髓者慎用。(2) 联合用药、老年及骨髓功能欠佳、多次化疗患者酌情降低剂量。(3) 定期检测白细胞计数和血小板计数。(4) 保证药液输入静脉。(5) 因有低血压的报道，在输注开始30 ~ 60分钟监测主要生命体征。(6) 本品有致癌性、致突变性和生殖毒性。

【禁忌证】对本品过敏者，严重白细胞计数、血小板减少者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见白细胞计数减少、血小板减少、贫血、恶心、呕吐、口腔炎、黏膜炎、厌食、腹泻、腹痛、肝功能异常、寒战、发热、心动过速、支气管痉挛、呼吸困难、荨麻疹、脱发、低血压、神经病变、感染、肾功能不全、高血压、头痛、神经混乱、肌无力等。

【用法与用量】静脉滴注：每疗程总剂量为300 mg/m^2，在3 ~ 5日给予，每3周或待骨髓功能恢复后可重复1个疗程。

【制剂与规格】替尼泊苷注射液：5 ml：50 mg。

10.3.1.5 干扰有丝分裂的药物

主要作用于有丝分裂M期，干扰微管蛋白合成的药物包括三大类，即长春碱类、紫杉烷类和高三尖杉酯碱，它们的共同特点是均为植物提取物或其半合成衍生物，作用机制为影响微管蛋白装配、干扰有丝分裂中纺锤体的形成，使细胞生长停滞于分裂中期。

（1）长春碱类药物：长春碱类包括硫酸长春新碱（硫酸醛基长春碱，Vincristine Sulfate），硫酸长春碱（硫酸长春花碱，Vinblastine Sulfate），硫酸长春地辛（硫酸长春花碱酰胺，Vindesine Sulfate）和酒石酸长春瑞滨（Vinorelbine Tartrate），用于治疗多种肿瘤，包括白血病、淋巴瘤和一些实体瘤（例如乳腺癌和肺癌）。前两者抗癌活性与其剂量有很大关系，后两者为人工半合成长春碱衍生物。

长春碱类药物进入肝内较多，瘤组织可选择性浓集，并且浓集于神经细胞较血细胞多，神经毒性重，很少通过血脑屏障。因此其共同的不良反应为骨髓抑制、消化道反应、神经系统毒性、血栓性静脉炎，尤其以后两者为主要特点。神经系统毒性为长春碱类药物的剂量限制性毒性，主要表现为四肢麻木、腱反射消失、腹痛和便秘，甚至麻痹性肠梗阻等。静脉反复注药可致血栓性静脉炎，注射时漏至血管外可造成局部坏死，应立即停止注射，以氯化钠注射液稀释局部，或以1%普鲁卡因注射液局封，温湿敷或冷敷，发生皮肤破溃后按溃疡处理。

长春新碱[保（甲）]

Vincristine

【适应证】用于急性白血病、急性和慢性淋巴细胞白血病、恶性淋巴瘤、生殖细胞肿瘤、小细胞肺癌、尤因肉瘤、肾母细胞瘤、神经母细胞瘤、乳腺癌、消化道癌、黑色素瘤和多发性骨髓瘤。

【注意事项】（1）应用本品应终止哺乳。（2）2岁以下儿童的周围神经的髓鞘形成尚不健全，应慎用。（3）有痛风病史、肝功能损害、感染、白细胞计数减少、神经肌肉疾病、尿酸盐性肾结石病史、近期接受过放疗或化疗者慎用。（4）定期检查周围血象、肝肾功能，注意观察心律、肠鸣音及腱反射等。（5）本品可使血钾、血及尿的尿酸升高。（6）一旦药液外漏应停止输液，并予相应处理。防止药液溅入眼内，一旦发生立即用大量氯化钠注射液冲洗，之后应用地塞米松眼膏保护。冲入静脉时应避免日光直接照射。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】可见四肢麻木、腱反射迟钝或消失、外周神经炎、腹痛、便秘、麻痹性肠梗阻、运动神经和感觉神经及脑神经症状、骨髓抑制、消化道反应、生殖系统毒性、脱发、血压改变、血栓性静脉炎、局部刺激和局部组织坏死。

【用法与用量】静脉注射或冲入：①成人。一次1～2 mg（或1.4 mg/m^2），一次量不超过2 mg，65岁以上者，一次最大量1 mg。②儿童。一次2 mg/m^{2}或按体重一次75 μg/kg，一周1次。联合化疗，连续2周为一周期。

【制剂与规格】注射用硫酸长春新碱：1 mg。

长春碱[保（乙）]

Vinblastine

【适应证】霍奇金病，淋巴细胞瘤，组织细胞性淋巴瘤，晚期蕈样真菌病，晚期睾丸肿瘤，Kaposi肉瘤，组织细胞增生症，绒癌，乳腺癌、卵巢癌，单核细胞白血病。

【注意事项】（1）哺乳期用药应终止哺乳。（2）可使血及尿内尿酸升高而干扰诊断。（3）骨髓抑制、痛风病史、肝功能损害、感染、肿瘤侵犯骨髓、尿酸盐性肾结石病史、经过放疗或化疗的患者慎用。（4）用药期间应注意检查血常规、血胆红素、ALT及AST、乳酸脱氢酶、血尿素氮、血尿酸、肌酐清除率。（5）本品有致癌作用。

【禁忌证】白细胞计数减少者、细菌性感染者、妊娠期妇女。

【不良反应】常见骨髓抑制、白细胞计数减少、恶心、呕吐、便秘、口疮、腹泻、倦怠、腹痛、直肠出血、喉炎、出血

性直肠结肠炎、消化性溃疡或出血、四肢麻木、感觉异常、外周神经炎、深部肌腱反射消失、头痛、惊厥、全身不适、软弱、头晕、精神抑郁、肿瘤部位疼痛、皮肤起疱、脱发、血栓性静脉炎、局部组织坏死、抑制睾丸或卵巢功能。

【用法与用量】静脉注射或滴注，严禁鞘内注射。(1) 成人，一次 3.7～10.1 mg/m²，不得超过 18.5 mg/m²，一周 1 次，剂量逐渐递增。(2) 儿童，一次 2.5～7.5 mg/m²，不得超过 12.5 mg/m²，一周 1 次，剂量逐渐递增。

【制剂与规格】硫酸长春碱注射液：10 ml : 10 mg。

长春地辛[保(乙)]

Vindensine

【适应证】用于非小细胞肺癌、小细胞肺癌、恶性淋巴瘤、乳腺癌、食管癌、恶性黑色素瘤。

【注意事项】(1) 严重白细胞计数及血小板低下者应停药。(2) 长春碱或鬼臼素类药物可能增加神经毒性，肝肾功能不全的患者慎用。(3) 避免漏出血管外和溅入眼内。(4) 药物溶解后应在 6 小时内使用。(5) 本品有致畸作用。

【禁忌证】骨髓功能低下者，严重感染者，妊娠期妇女。

【不良反应】常见白细胞计数降低、中性粒细胞减少、血小板减少、食欲减退、恶心、呕吐、末梢神经炎、腹胀、便秘、静脉炎。

【用法与用量】静脉滴注：单药一次 3 mg/m²，一周 1 次，联合化疗时剂量酌减。连续用药 4～6 次完成疗程。氯化钠注射液溶解后缓慢静脉注射，亦可溶于 5% 葡萄糖注射液 500～1 000 ml 中缓慢静脉滴注（6～12 小时）。

【制剂与规格】注射用硫酸长春地辛：① 1 mg；② 4 mg。

长春瑞滨[保(乙)]

Vinorelbine

【适应证】用于非小细胞肺癌及乳腺癌。

【注意事项】(1) 治疗须在血液学监测下进行。粒细胞 $<0.2\times10^9$/L 时应延迟至患者血象恢复正常再用药。(2) 肝功能不全时应减量。如无法检测肾功能，须谨慎用药。缺血性心脏病患者须慎用。(3) 外渗可引起严重局部刺激，应立即停止注药，渗出部位局部皮下注射 1ml 透明质酸（250 U/ml）和采用热敷措施，余药从另一静脉输入。(4) 治疗操作时谨防药物污染眼球而引起严重刺激甚至角膜溃疡，一旦发生应立即冲洗。(5) 进行肝脏放疗时忌用本品。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女、严重肝功能不全者。

【不良反应】常见粒细胞减少、贫血、深腱反射消失、感觉异常、下肢无力、麻痹性肠梗阻、便秘、恶心、呕吐、呼吸困难、支气管痉挛、心肌缺血、脱发、下颌痛、局部皮肤红肿甚至坏死。

【用法与用量】仅供静脉使用。单药，一周 25～30 mg/m²。联合化疗，依据所用方案选择剂量与给药时间。本品须溶于氯化钠注射液，于 15～20 分钟输入，然后输入大量氯化钠注射液冲洗静脉。

【制剂与规格】重酒石酸长春瑞滨注射液：① 1 ml : 10 mg；② 5 ml : 50 mg。

(2) 干扰微管蛋白合成的药物：紫杉烷类药物是一类新型抗微管药物，可促进微管双聚体装配成微管并通过干扰去多聚化过程使微管稳定，从而抑制微管网正常动力学重组导致细胞分裂受阻。它是一类广谱抗肿瘤药，包括紫杉醇和多西他赛，其作用机制相似，但抗瘤谱并不完全一致，两者的不良反应亦不完全一致，如紫杉醇因其以特殊溶媒 Cremophor-EL 进行溶解而可能导致严重的超敏反应，需常规进行糖皮质激素、抗组胺药和组胺 H_2 受体拮抗药的预处理，以防止严重的超敏反应。紫杉醇的外周神经毒性也更为常见，其具体机制尚未明了，可能与剂量累积有关，也可能与溶媒的神经毒性有关；紫杉醇另一重要不良反应为心脏毒性，更常见的只有心动过缓和无症状的低血压。多西他赛与其相比，神经毒性和心脏毒性都较轻，但其骨髓抑制较明显，为主要剂量限制性毒性，另外其可导致持续的液体潴留，也

会发生超敏反应，因此建议口服地塞米松以减少液体潴留和超敏反应。

紫杉醇[保(乙)]

Paclitaxel

【适应证】用于卵巢癌、乳腺癌、非小细胞肺癌、头颈癌、食管癌、精原细胞瘤、复发非霍奇金淋巴瘤及与 AIDS 相关性卡波西肉瘤。

【注意事项】(1) 治疗前使用地塞米松、苯海拉明和 H_2 受体拮抗药预防过敏。(2) 骨髓抑制是剂量限制性毒性反应。(3) 输注期间若出现传导异常，应密切观察，必要时给予治疗。(4) 肝功能不全的患者慎用。(5) 哺乳期妇女用药应停止哺乳。(6) 本品溶液不应接触聚氯乙烯塑料 (PVC) 装置、导管或器械。滴注时先经 0.22 μm 孔膜滤过。

【禁忌证】对本品或聚氧乙基代蓖麻油过敏者，中性粒细胞计数 $< 1\,500/mm^3$ 的实体瘤患者，中性粒细胞计数 $< 0.1 \times 10^9/L$ 的 AIDS 相关性卡波西肉瘤患者，妊娠期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见骨髓抑制、中性粒细胞减少、血小板减少、发热、贫血。(2) 呼吸系统：可见呼吸困难、面部潮红、胸痛、间质性肺炎、肺纤维化、肺栓塞。(3) 消化系统：可见恶心、呕吐、腹泻、胆红素升高、碱性磷酸酶升高、AST 升高。(4) 循环系统：可见心律失常、心动过缓、低血压或高血压、心电图异常、心肌梗死、房颤、室上性心动过速。(5) 中枢神经系统：可见寒战、背痛、运动神经异常、感觉神经异常、自主神经异常、视神经异常、关节痛、肌痛。(6) 泌尿系统：可见肾功能异常及血肌酐升高。(7) 其他：可见黏膜炎、脱发、皮疹、指甲改变、水肿和注射部位反应。(8) 脂质体的上述反应较注射液者为少。

【用法与用量】(1) 预防用药：在治疗前 12 小时及 6 小时口服地塞米松 20 mg，治疗前 30 ~ 60 分钟肌内注射苯海拉明 50 mg，以及治疗前 30 ~ 60 分钟静脉注射西咪替丁 300 mg 或雷尼替丁 50 mg。(2)静脉给药：滴注时间 > 3 小时。①单药，一次 135 ~ 200 mg/m^2，在 G-CSF 支持下剂量可达 250 mg/m^2。②联合用药，一次 135 ~ 175 mg/m^2，3 ~ 4 周一次。

【制剂与规格】紫杉醇注射液：① 5 ml : 30 mg；② 25 ml : 0.15 g；③ 16.7 ml : 0.1 g。

注射用紫杉醇脂质体：40 mg。

多西他赛[保(乙)]

Docetaxel

【适应证】用于局部晚期或转移性乳腺癌、局部晚期或转移性非小细胞肺癌，即使是在以顺铂为主的化疗失败后。

【注意事项】(1) 须在有经验的医师指导下使用。因可能发生较严重的过敏反应，应具备相应的急救设施，注射期间密切监测主要功能指标。(2) 除非有禁忌，患者在接受本品治疗前需预防用药以减轻体液潴留的发生率和严重程度，以及减轻过敏反应的严重程度，预防用药包括口服皮质类固醇，如地塞米松 16 mg (8 mgBID)，在本品注射前一日开始服用，持续 3 日。(3) 注意本品在血液学、过敏反应、皮肤反应、体液潴留、肝功能损害、神经系统及其他方面的毒性。(4) 应遵循细胞毒类药物配置规程。(5) 用药期间如发生发热性中性粒细胞减少且持续 1 周以上低于 $500/mm^3$，出现严重或蓄积性皮肤反应或外周神经症状，应酌情减量。(6) 肝功能损伤的患者，对于血清胆红素超过正常值上限和（或）ALT 及 AST 超过正常上限 3.5 倍并伴有碱性磷酸酶超过正常值上限 6 倍的患者，除非有严格的使用指征，否则不应使用，也无减量使用建议。

【禁忌证】对本品或赋形剂过敏者，基线中性粒细胞计数 $< 0.15 \times 10^9/L$ 者，妊娠及哺乳期妇女，肝功能严重损害者，当与其他药物联用时应遵循其他药物的禁忌。

【不良反应】(1) 血液系统：可见中性粒细胞减少、贫血、感染，发热性中性粒细胞减少、血小板减少、G3/4 感染合并中性粒细胞计数 $< 0.05 \times 10^9/L$，出血，出血合并 G3/4 血小板减少。(2) 呼吸系统：可见支气管痉挛、胸闷、呼吸困难、背痛、急性呼吸窘迫综合征、间质性肺炎、肺纤维化。(3) 消化系统：可见口腔炎、腹泻、恶心、呕吐、味觉异常、便秘、腹

痛、胃肠道出血，食管炎、腹水、体重增加、胆红素升高、碱性磷酸酶升高、ALT及AST升高，罕见肝炎、厌食。(4) 中枢神经系统：可见感觉神经症状，少见惊厥或暂时性意识丧失、视觉障碍、肌痛、关节痛、药物性发热或寒战。(5) 循环系统：可见心律失常、低血压或高血压、心力衰竭、胸膜腔积液、心包积液。(6) 其他：伴或不伴有结膜炎的流泪、色素沉着、过敏反应、瘙痒、红斑、皮疹、皮肤发红或发干、脱发、指甲改变和外周水肿、静脉炎，罕见放射回忆现象。

【用法与用量】静脉滴注：一次75 mg/m^2，滴注1小时，3周1次。

【制剂与规格】注射用多西他赛：① 20mg；② 80 mg。

10.3.1.6 其他细胞毒类药

门冬酰胺酶[保(甲)]

Asparaginase

【适应证】用于急性淋巴细胞性白血病、急性粒细胞性白血病、急性单核细胞性白血病、慢性淋巴细胞性白血病、霍奇金病及非霍奇金病淋巴瘤和黑色素瘤。

【注意事项】(1) 肝肾损害、骨髓功能抑制、合并感染、糖尿病、痛风或肾尿酸盐结石、接受过细胞毒药物或放疗者慎用。(2) 用药期间密切监测凝血功能，警惕可能发生严重胰腺炎及骨髓功能抑制等不良反应。(3) 儿童及育龄患者慎用，哺乳期妇女应停止哺乳。(4) 来源于大肠埃希菌与来源于欧文菌族的门冬酰胺酶间偶有交叉敏感发生。(5) 接受本品治疗3个月内不得接种活病毒疫苗。(6) 可干扰甲状腺功能试验、肝功能、血糖、血氨、血钙、尿素氮、尿酸、凝血酶时间的测定与诊断。(7) 患者须住院治疗，首次使用或用过本品但已停药1周或以上者，在注射本品前须做皮试。(8) 忌用0.9%氯化钠注射液溶解，溶解后尽快使用，仅用于静脉滴注。

【禁忌证】对本品有过敏史或皮试阳性者，有胰腺炎病史或现患胰腺炎者，患水痘、广泛带状疱疹等严重感染者，妊娠期妇女。

【不良反应】可见过敏反应、休克、荨麻疹、血管肿胀、皮疹、瘙痒、面部水肿、关节肿痛、寒战、呕吐、ALT及AST升高、胆红素升高、肝衰竭、腹痛、恶心、呕吐、腹泻，严重者可发生急性胰腺炎。偶见呼吸困难、意识不清、痉挛、血压下降、血糖过高、高氨血症、高尿酸血症、高热、昏迷、意识障碍、定向障碍、广泛脑器质性障碍、凝血功能异常、脑出血或脑梗死、肺出血、血浆纤维蛋白原减少、凝血酶原减少、纤维蛋白溶酶原减少、血清白蛋白浓度降低。

【用法与用量】静脉滴注：根据病种和治疗方案的不同，用量存在较大差异。以急淋的诱导缓解方案为例，一日500 U/m^2，或一日1 000 U/m^2，最高可达一日2 000 U/m^2，10～20日为1个疗程。

【制剂与规格】注射用门冬酰胺酶：① 5 000 U；② 10 000 U。

达卡巴嗪[保(乙)]

Dacarbazine

【适应证】用于恶性黑色素瘤、软组织肿瘤及恶性淋巴瘤。

【注意事项】(1) 肝肾功能损害、感染者慎用。(2) 用药期间应停止哺乳。(3) 用药期间禁止接种活性病毒疫苗。(4) 可引起血尿素氮、AST及ALT、乳酸脱氢酶暂时升高。(5) 定期检查血尿素氮、血肌酐、血尿酸、血清胆红素、ALT及AST、乳酸脱氢酶。(6) 本品对光和热极不稳定，在水中不稳定，需临时配制，尽量避光。(7) 静脉滴注速度不宜太快，防止药液外漏。

【禁忌证】水痘或带状疱疹患者，严重过敏史者，妊娠期妇女。

【不良反应】可见白细胞计数和血小板减少、贫血、食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、黏膜炎、全身不适、发热、肌肉痛、面部麻木、脱发、注射部位刺激反应，偶见肝肾功能损害，罕见肝静脉血栓形成所致的肝坏死。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：一次2.5～6 mg/kg或一次200～400 mg/m^2，用氯化钠注射液10～15 ml溶解后，用5%葡萄糖溶液250～500 ml稀释，滴注30分钟以上，一日1次，连续5～10日为1个疗程，每3～6周重复给药；单次

大剂量，650～1 450 mg/m^2，每4～6周1次。(2) 静脉注射：一次200 mg/m^2，一日1次，连续5日，每3～4周重复给药。(3) 动脉灌注：位于四肢的恶性黑色素瘤，可用同样剂量动脉注射。

【制剂与规格】注射用达卡巴嗪：① 0.1 g；② 0.2 g。

丙卡巴肼[保(甲)]

Procarbazine

【适应证】用于恶性淋巴瘤，如恶性黑色素瘤、多发骨髓瘤、脑瘤（原发或继发）等。

【注意事项】(1) 定期监测肝、肾功能。(2) 肝肾功能不全、糖尿病（本品能加强降糖药的作用）、严重感染、近期经过放疗或化疗者应减量。(3) 对儿童及青少年长期大剂量用药可有潜在的致癌、致畸性，故临床上可使用其他药物如依托泊苷替代。(4) 老年人可酌情减量。哺乳期妇女用药不确定。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠尤其妊娠初期3个月内妇女禁用。

【不良反应】(1) 骨髓抑制为剂量限制性毒性，可致白细胞及血小板减少，出现较迟，一般发生于用药后4～6周，2～3周后可恢复。(2) 常见恶心、呕吐、食欲缺乏，偶见口腔炎、口干、腹泻、便秘、眩晕、嗜睡、精神错乱、脑电图异常、肝损害、皮炎、皮肤色素沉着、脱发、外周神经炎等。

【用法与用量】口服：成人一次50 mg，一日3次，临睡前顿服，以减轻胃肠道反应，连续2周，4周重复。若白细胞计数低于3.0×10^9/L，血小板计数低于80×10^9/L时应停药。血常规恢复后剂量减为一日50～100 mg。小儿一日3～5 mg/kg或100 mg/m^2，分次口服，服药1～2周，停药2周。

【制剂与规格】盐酸丙卡巴肼肠溶片：① 25 mg；② 50 mg。

甘氨双唑钠[保(乙)]

Sodium Glycididazole

【适应证】放射增敏药，适用于对头颈部肿瘤、食管癌、肺癌等实体肿瘤进行放射治疗的患者。

【注意事项】(1) 本品必须伴随放射治疗使用，单独使用本品无抗癌作用。(2) 在使用本品时若发生过敏反应，应立即停止给药并采取适当的措施。(3) 使用本品时应注意监测肝功能和心电图变化，特别是肝功能、心脏功能异常。(4) 包装破损或稀释液不澄明的禁止使用。

【禁忌证】肝、肾和心脏功能严重异常者禁用。孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】使用中有时会出现ALT、AST的轻度升高和心悸、窦性心动过速、轻度ST段改变。偶尔出现皮肤瘙痒、皮疹和恶心、呕吐等。

【用法与用量】静脉滴注：按体表面积一次800 mg/m^2，于放射治疗前加入到100 ml氯化钠注射液中充分摇匀后，30分钟内滴完。给药后60分钟内进行放射治疗。建议于放射治疗期间按隔日1次，一周3次用药。

【制剂与规格】注射用甘氨双唑钠：0.25 g（按无水物计）。

甲异靛[保(乙)]

Meisoindigo

【适应证】用于治疗慢性粒细胞白血病，对真性红细胞增多症、骨髓纤维化、银屑病等也有很好疗效。

【注意事项】(1) 获得最佳疗效的时间较长，必须保证足够的剂量和时间。(2) 应定期检查白细胞及血小板数，出现不良反应时应对症处理，停药后恢复正常。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见恶心、食欲缺乏、关节疼痛；极个别患者出现骨髓抑制。

【用法与用量】口服：一次50 mg，一日2～3次，餐后服用，一日治疗量不宜超过150 mg。

【制剂与规格】甲异靛片：25 mg。

靛玉红

Indirubin

【适应证】用于慢性粒细胞白血病。

【注意事项】(1) 心、肝肾功能不全者，胃肠道有活动性溃疡或炎性病变者慎用。(2) 根据患者耐受性及疗效调整剂量。

(3) 用药期间出现严重腹泻、腹痛、便血、呕吐、肠套叠、头痛、心血管异常、心电图异常等症状应立即停药，采取相应处理并做出鉴别诊断。(4) 慢性粒细胞等患者服用本品达 6 ~ 8 周而临床及血或骨髓象均未见明显改善，应考虑停用，改用其他治疗。(5)避免在妊娠期、哺乳期使用本品。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】可见腹痛、脐周痛、恶心、呕吐、大便次数增多、里急后重、便血、肝功能损害、肠套叠、骨髓轻度抑制、白细胞计数减少、头痛、面部及下肢水肿、失眠、关节痛、骨痛、咳嗽、胸闷、气促、心脏扩大、肺动脉增宽，心电图可显示电轴右偏，肺型 P 波，肺动脉高压等。

【用法与用量】口服：成人一日 50 ~ 300 mg，一般一日 200 mg，分 3 ~ 4 次服，至缓解或以 3 个月为 1 个疗程。缓解后需较长期维持服用。

【制剂与规格】靛玉红片：① 25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

三尖杉酯碱[保(乙)]

Harringtonine

【适应证】用于治疗急性粒细胞性白血病、急性单核细胞性白血病，对骨髓增生不良综合征（MDS）、真性红细胞增多症、慢性粒细胞性白血病亦有一定的疗效。

【注意事项】(1) 白血病时有大量白细胞破坏，采用本品时破坏会更增多，血液及尿中尿酸浓度可能增高。(2) 心血管疾病：原有心律失常及各类器质性心血管疾病患者应慎用或不用本品。对严重或频发的心律失常及器质性心血管疾病患者则不选用本品。(3) 下列情况也应慎重：骨髓功能显著抑制或血象呈严重粒细胞减少或血小板减少、肝功能或肾功能损害，有痛风或尿酸盐肾结石病史患者。(4) 用药期间应密切观察下列各项：① 周围血象，每周应检查白细胞计数及分类、血小板、血红蛋白 1 ~ 2 次，如白细胞在短期内有急剧下降现象者，则应每日观察血象；② 肝、肾功能；③ 心脏体征及心电图检查。(5) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(6) 由于老年患者对化疗耐受性较差，因而选用本品时亦需加强支持疗法，并严密观察各种不良反应。

【不良反应】(1) 骨髓抑制：主要为白细胞和血小板减少，属可恢复性的。(2) 胃肠道反应：食欲缺乏、恶心、呕吐。(3) 心脏毒性：心动过速、胸闷、心悸，偶有心律失常，甚至心力衰竭。若引起心房扑动应立即停药，部分病例有心肌损害。(4) 其他：头晕、乏力、注射局部疼痛。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：成人一日 1 ~ 4 mg，儿童一日 0.05 ~ 0.3 mg/kg，加 5% 葡萄糖注射液 200 ~ 500 ml 缓慢滴注，一日 1 次，5 ~ 10 日为 1 个疗程，疗程间隔 7 ~ 14 日。(2) 鞘内注射：神经系统白血病成人一次 0.5 mg，9 岁以下一次 0.3 mg，10 岁以上一次 0.4 mg，用氯化钠注射液稀释至 4 ~ 5 ml 缓慢注入鞘内，5 ~ 7 日 1 次，直至脑脊液转阴后改为每周 1 次，连用 2 次。

【制剂与规格】三尖杉酯碱注射液：① 1 ml ∶ 1 mg；② 2 ml ∶ 2 mg。

高三尖杉酯碱[保(甲)]

Homoharringtonine

【适应证】用于急性非淋巴细胞白血病、骨髓增生异常综合征、慢性粒细胞性白血病和真性红细胞增多症。

【注意事项】(1) 老年患者、心律失常、器质性心血管病、肝肾功能不全、骨髓功能显著抑制、严重粒细胞或血小板减少、肝肾功能损害、痛风或尿酸盐肾结石病史的患者慎用。(2) 会引起血及尿尿酸浓度增高而干扰诊断。(3) 静脉滴注速度过快或长期持续或重复给药时，会产生心脏毒性。对原有心律失常及器质性心血管疾病患者应慎用或不用。(4) 定期检查周围血象、肝肾功能、心脏体征及心电图。(5) 慎与碱性药物配伍。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女，严重或频发的心律失常者，器质性心血管疾病者。

【不良反应】可见骨髓抑制、厌食、恶心、呕吐、肝功能损害、脱发、皮疹、过敏性休克、心脏毒性、窦性心动过速、房性或室性期前收缩，心电图出现 ST 段变化及 T 波平坦、奔马律、房室传导阻滞及束支传导阻滞、心房颤动及低血压。

【用法与用量】静脉滴注：①成人。

一日 1 ~ 4 mg，溶于5%或10%葡萄糖注射液250 ~ 500 ml，缓慢滴入3小时以上，4～6日为1个疗程，间歇1～2周再重复用药。②儿童。一日0.05～0.1 mg/kg，4 ~ 6日为1个疗程。

【制剂与规格】高三尖杉酯碱注射液：1 ml : 1 mg。

10.3.2 激素类药

目前的内分泌治疗中除甲状腺激素对甲状腺癌的控制以外，都涉及了甾体激素（类固醇类激素）浓度或活性的改变。甾体激素，包括雌激素、孕激素、雄激素和肾上腺皮质激素等，这些激素都有共同的基本结构，即甾核。激素类药物在乳腺癌、前列腺癌及子宫内膜癌的治疗中发挥了重要作用。在治疗过程中应密切观察肿瘤疗效、药物毒性，并在肿瘤进展或毒性超出获益时，对治疗药物进行替换。

10.3.2.1 雌激素及抗雌激素类

（1）雌激素类：己烯雌酚（Diethylstilbestrol/Stilboestrol）的作用机制一般认为是利用雌激素对下丘脑 - 垂体 - 性腺轴的负反馈作用。常见的与剂量相关的不良反应包括恶心、体液潴留、静脉或动脉血栓栓塞。男性常发生阳痿和男性乳房发育。女性常发生撤退性出血。乳腺癌患者易发生高钙血症和骨痛。由于其不良反应较多，目前已很少用于治疗前列腺癌。有时候用于治疗绝经后乳腺癌。常用药物包括己烯雌酚、炔雌醇。（其他见第12章妇产科疾病用药）。

（2）抗雌激素类：抗雌激素类药物主要包括他莫昔芬（Tamoxifen）和托瑞米芬（Toremifene）。其中他莫昔芬是目前临床上最常用的内分泌治疗药物，主要用于治疗乳腺癌（ER阳性患者，绝经前、后均可使用）、化疗无效的晚期卵巢癌和晚期子宫内膜癌。

乳腺癌细胞的胞浆内存在雌激素受体，他莫昔芬和雌激素均可自由地通过细胞膜，并与雌激素竞争性结合胞浆内的雌激素受体，形成他莫昔芬 - 受体蛋白复合物，该复合物进入乳腺癌细胞核内，不能像雌激素与受体结合的复合物一样促使癌细胞的DNA与mRNA结合，结果抑制了雌激素依赖性蛋白质的结合，并最终抑制了乳腺癌细胞的增殖。

多数患者对他莫昔芬耐受性较好，不良反应较少，主要有：①轻微的胃肠道反应，食欲减退、恶心、呕吐、腹泻等，无需特殊处理。②生殖系统反应，月经失调、闭经、阴道出血、外阴瘙痒、子宫内膜增厚等，这些反应系他莫昔芬的类雌激素样作用所致，一般较轻微，严重者停药后可逐渐恢复。值得注意的是，他莫昔芬可致子宫内膜癌，发生率约0.3%。③皮肤反应，面部潮红、皮疹、脱发。严重过敏性皮疹患者可停药。④神经精神症状，头痛、眩晕、抑郁。⑤其他，个别患者长期服用会出现肝功能异常，视力障碍等。对症治疗如不能很好缓解，可暂停他莫昔芬治疗。

托瑞米芬的化学结构与他莫昔芬相似，该药的类雌激素样作用比他莫昔芬弱，因此该药抗肿瘤活性与他莫昔芬相当或略高，但不良反应较少。

芳香化酶抑制药（AI）通过抑制芳香化酶的活性，阻断卵巢以外的组织雄烯二酮及睾酮经芳香化作用转化成雌激素，达到抑制乳癌细胞生长，治疗肿瘤的目的。由于其不能抑制卵巢功能，故不能用于绝经前乳腺癌患者。

他莫昔芬[保(甲)]

Tamoxifen

【适应证】用于复发转移乳腺癌、乳腺癌术后的辅助治疗。

【注意事项】(1) 肝肾功能异常者慎用。(2) 有骨转移患者在治疗初期需定期查血钙。(3) 运动员慎用。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女，有眼底疾病者。

【不良反应】常见食欲减退、恶心、呕吐、腹泻、月经失调、闭经、阴道出血、外阴瘙痒、子宫内膜增生、子宫内膜息肉和子宫内膜癌、面部潮红、皮疹及脱发；偶见白细胞计数和血小板减少、肝功异常；罕见精神错乱，肺栓塞（表现为气短）、血栓形成、乏力、嗜睡。

【用法与用量】口服：一次10 ~ 20 mg，一日2次。

【制剂与规格】枸橼酸他莫昔芬片（以他莫昔芬计）：① 10 mg；② 20 mg。

托瑞米芬[保（乙）]

Toremifene

【适应证】用于绝经后妇女雌激素受体阳性或不详的转移性乳腺癌。

【注意事项】治疗前应检查是否子宫内膜异常，高血压，糖尿病患者，肥胖高体重指数（> 30）患者或有雌激素替代治疗的患者。对非代偿性心功能不全及严重心绞痛患者应密切观察。骨转移患者用本品可能出现高钙血症，应严密监测。运动员慎用，肝功能损害患者慎用。

【禁忌证】有子宫内膜增生症或严重肝衰竭者禁止长期服用。对本品及辅料过敏者禁用。有血栓性疾病史患者禁用。妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】可见面部潮红、多汗、子宫出血、阴道出血、子宫肥大、子宫息肉、子宫内膜增生、子宫内膜癌、白带增多、恶心、呕吐、便秘、ALT 及 AST 升高、黄疸、皮疹、瘙痒、头晕、头痛、失眠，眩晕、疲乏、抑郁、水肿、体重增加、呼吸困难、一过性角膜不透明、血栓、高钙血症。

【用法与用量】口服：推荐剂量一次 60 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】枸橼酸托瑞米芬片：60 mg。

氨鲁米特[保（甲）]

Aminoglutethimide

【适应证】绝经后或卵巢切除后的晚期乳腺癌、雌激素受体或孕激素受体阳性患者。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女不能使用。(2) 老年人肾功能减退，可使药物在体内蓄积引起神经系统毒性，应慎用。(3) 休克期不宜使用。(4) 若出现严重药疹或药疹持续 1 周以上，应停药并对症治疗。(5) 对诊断的干扰：服用本品后，血浆皮质激素、尿醛固醇值可减少、血清碱性磷酸酶、胆红素、ALT 及 AST、TSH 值可增加。(6) 定期复查血常规、血电解质、血清碱性磷酸酶、ALT 及 AST。

【禁忌证】合并感染，带状疱疹，肝肾功能损害，未控制的糖尿病，甲状腺功能严重减退，对本品严重过敏者，儿童。

【不良反应】可见发热、皮疹、嗜睡、眩晕、共济失调、眼球震颤、恶心、呕吐、腹泻、骨髓抑制、甲状腺功能减退、直立性低血压、皮肤发黑及女性性征男性化。

【用法与用量】口服：一次 250 mg，逐增至一日 4 次。维持剂量相同。同时口服氢化可的松 40 mg（早晨及下午 5 时各 10 mg，临睡前 20 mg），以防止因肾上腺皮质产生氢化可的松减少而引起的脑垂体对肾上腺皮质激素反馈性增加。用于皮质醇增多症时，应根据病情增减剂量。

【制剂与规格】氨鲁米特片：① 0.125 g；② 0.25 g。

阿那曲唑[保（乙）]

Anatrozole

【适应证】用于绝经后妇女激素受体阳性的晚期乳腺癌、雌激素受体阴性并对他莫昔芬呈阳性反应，绝经后妇女激素受体阳性的早期乳腺癌的辅助治疗。

【注意事项】(1) 不推荐用于儿童。(2) 运动员慎用。(3) 伴有骨质疏松或潜在骨质疏松风险的妇女应在治疗开始及其后定期检查骨密度，并适时给予预防与治疗，尚无双膦酸盐预防本品引起骨质疏松的报道。(4) 注意本品引起的乏力和嗜睡症状对驾驶和机械操作能力的影响。

【禁忌证】绝经前，妊娠及哺乳期妇女，严重肾功能损害，中、重度肝功能损害，对本品及辅料过敏者，与其他含雌激素疗法伍用，合并使用他莫昔芬。

【不良反应】(1) 生殖系统：可见阴道干涩、阴道出血、阴道溢液、子宫内膜癌。(2) 消化系统：可见恶心、呕吐、腹泻、厌食、消化不良、胃肠道不适、肝功能改变、体重增加。(3) 骨关节系统：可见关节炎、关节痛、骨质疏松症、骨折、骨痛、关节病、关节异常、肌痛。(4) 中枢神经系统：可见抑郁、失眠、头晕、头痛、疲乏、嗜睡、衰弱。(5) 循环系统：可见心绞痛、心肌梗死、冠状动脉异常、心肌缺血、高胆固醇血症、深静脉血栓栓塞、

外周水肿、缺血性脑血管事件。(6) 血液系统：可见贫血、淋巴水肿。(7) 皮肤及感觉系统：可见潮热、毛发稀疏、多形性红斑、白内障 Stevens-Johnson 综合征、血管性水肿、荨麻疹及过敏。

【用法与用量】口服：一次 1 mg，一日 1 次，对早期乳腺癌推荐疗程为 5 年。

【制剂与规格】阿那曲唑片：1 mg。

来曲唑[保(乙)]

Letrozol

【适应证】绝经后激素受体阳性的晚期乳腺癌患者、早期乳腺癌的术后辅助治疗。

【注意事项】(1) 严重肝功能不全的患者，其全身药物浓度和药物的终末半衰期接近健康志愿者的 2 倍，应严密观察。(2) 没有在肌酐清除率 < 10 ml/min 的女性中使用过本品。(3) 运动员慎用。

【禁忌证】对本品及其辅料过敏者，儿童，妊娠、哺乳期及绝经前妇女，严重肝功能不全者。

【不良反应】常见恶心、呕吐、消化不良，便秘、腹泻、食欲减退、食欲增加、体重增加、头痛、头晕、高血压、发热、面部潮红、脱发、多汗、红斑、斑丘疹、银屑病、皮肤疱疹、肌痛、骨痛、关节痛、关节炎、疲乏、虚弱、全身不适、水肿；少见尿道感染、白细胞计数减少、高胆固醇、体重降低、抑郁、焦虑、紧张、易怒、精神不振、嗜睡、失眠、记忆力损伤、感觉障碍、感觉异常、味觉障碍、白内障、眼部刺激、视物模糊、心悸、心动过速、血栓性静脉炎、肺栓塞、动脉血栓、脑血管梗死、低血压、呼吸困难、腹痛、口腔炎、口干、黏膜干燥、ALT 及 AST 升高、瘙痒症、皮肤干燥、风疹、尿频、阴道出血、阴道异常分泌、阴道干燥、乳腺疼痛、发热、口渴，长期应用可致骨质疏松和骨折。

【用法与用量】口服：一次 2.5 mg，一日 1 次，治疗持续到肿瘤出现进展为止。

【制剂与规格】来曲唑片：2.5 mg。

依西美坦[保(乙)]

Exemestane

【适应证】用于经他莫昔芬治疗后病情进展的绝经后晚期乳腺癌，早期乳腺癌的术后辅助治疗。

【注意事项】(1) 用药前评估 LH、FSH 和雌二醇水平确认妇女是否处于绝经后状态。(2) 中重度肝肾功能不全者慎用。(3) 超量服用可使非致命性不良反应增加。

【禁忌证】对本品或其辅料过敏者，绝经前，妊娠及哺乳期妇女，儿童。

【不良反应】可见面部潮红、恶心、呕吐、厌食、口干、疲乏、发热、出汗、头晕、头痛、失眠、疼痛、皮疹、腹痛、抑郁，脱发、全身或下肢水肿、便秘、消化不良、食欲和体重增加、高血压、焦虑、嗜睡、精神不振、衰弱、血小板减少、淋巴细胞减少、ALT 及 AST 和碱性磷酸酶升高。

【用法与用量】口服：一次 25 mg，一日 1 次，宜餐后服用。治疗持续到肿瘤进展为止。

【制剂与规格】依西美坦片：25 mg。

10.3.2.2 孕激素类

孕激素类药物主要包括甲羟孕酮 (Medroxyprogesterone) 及甲地孕酮 (Megestrol acetate)。主要适应证为乳腺癌、子宫内膜癌、前列腺癌、肾癌，也可用于改善晚期肿瘤患者的恶病质。

孕激素的主要不良反应如下。可引起乳房痛、溢乳、阴道出血、闭经、月经失调、宫颈糜烂、宫颈分泌异常等。也有肾上腺皮质作用：满月脸、类库欣（Cushingoid）综合征、体重增加和雄激素样作用、手颤、出汗、夜间小腿疼痛，偶有黄疸。血栓性静脉炎、血栓栓塞性疾病、严重的肝功能不全和因骨转移产生的高钙血症患者禁用。月经过多、妊娠和已知对甲羟孕酮过敏者忌用。另外，因孕激素能明显的增加体重及食欲，正在接受治疗的糖尿病及高血压患者不宜长期使用。

10.3.2.3 雄激素及抗雄激素类

(1) 雄激素类：雄激素主要被用于晚期乳腺癌的治疗，但目前已基本上被其他药物所替代。这类药物用于乳腺癌的作用机制还不明确，可能是通过抑制垂体分泌促卵泡生成素，使卵巢分泌雌激素减少、

并可对抗雌激素的作用。不良反应包括长期大量应用可引起性功能紊乱，在男性可引起性欲亢进、粉刺，药物可能抑制促性腺激素的分泌而引起睾丸萎缩和抑制精子生成，又由于抑制内源性睾酮的产生，可导致阳痿；女性患者应用后引起男性化；胆汁淤积性肝细胞损害；长期应用雄激素，可能出现肝癌、前列腺癌和肾细胞癌。有水钠潴留作用，可引起水肿、肾病和心力衰竭患者慎用。妊娠期妇女、前列腺癌者禁用。常用药物包括丙酸睾酮等。

（2）抗雄激素类：抗雄激素类药的代表药为氟他胺。该药是一种非甾体类的雄激素拮抗药，适用于晚期前列腺癌患者。其作用机制为此药与雄激素竞争肿瘤部位的雄激素受体，组织细胞对雄激素的摄取，抑制雄激素与靶器官的结合。该药的主要不良反应系因治疗过程中雄激素作用减少所致，如男性乳房女性化，乳房触痛、溢乳等，减少剂量或停药后症状消失。少数患者会出现腹泻、恶心、呕吐、食欲增加、失眠或疲倦等症状，一般不影响用药。性欲减退，暂时性肝功能异常和精子计数减少罕见。此药对心血管的潜在性影响较小。因此药可能增加睾酮和雌二醇的血浆浓度，可能发生体液潴留。对氟他胺过敏者禁用此药。长期服用此药，应定期检查肝功能和精子计数，当肝功能异常和黄疸时，应减量或停药，通常肝功能可以恢复。

氟他胺[保(乙)]

Flutamide

【适应证】适用于以前未经治疗，或对激素控制疗法无效或失效的晚期前列腺癌患者，它可被单独使用（睾丸切除或不切除）或与促黄体生成激素释放激素（LHRH）激动药合用。作为治疗局限性B2-C2（T2b-T4）型前列腺癌症的一部分，本品也可缩小肿瘤体积和加强对肿瘤的控制及延长无病生存期。

【注意事项】（1）本品有可能造成肝功能损害，AST及ALT高于正常值2～3倍的患者不能服用本品。须定期监测肝功能。如患者黄疸加重或AST及ALT高于正常值2～3倍，即使无临床症状，亦应停用本品。（2）本品与LHRH激动药联合用药治疗时，应了解每个药可能出现的不良反应，没有医师的指导，患者不可以随意停药或改变剂量方案。（3）本品可引起体液潴留，故心脏病患者慎用。（4）未接受药物或手术去势的患者，长期使用本品应定期进行精子计数检查。如发生异常应减量或停药，一般可恢复正常。（5）与华法林同服时，应调整华法林的剂量。（6）本品可增加睾酮和雌二醇的血浆浓度，可能发生体液潴留。（7）本品可单独应用，也可与LHRH激动药、化疗药联合应用。对良性前列腺增生也有一定的疗效。

【禁忌证】对本品成分过敏者、妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】单药应用可见男子乳房发育和（或）乳房触痛，有时伴溢乳；对心血管的潜在性影响比己烯雌酚小；另可见恶心、呕吐、食欲增强、失眠和疲乏、暂时性肝功能异常和肝炎、性欲减退、胃不适、厌食、溃疡痛、胃灼热、便秘、水肿、瘀斑、带状疱疹、瘙痒、狼疮样综合征、头痛、头晕、乏力、不适、视物模糊、口渴、胸痛、忧虑、压抑、淋巴水肿、精子数量减少。本品与LHRH激动药合用出现热潮红、性欲减低、阳痿、腹泻、恶心、呕吐；联合用药较单一使用氟他胺时男子乳房女性化减少；贫血、白细胞计数减少、非特异性胃肠功能紊乱、注射部位刺痒和皮疹、水肿、神经肌肉症状、黄疸、泌尿系症状、高血压、中枢神经系统不良反应（嗜睡、抑郁、昏迷、忧虑、神经质）、血小板减少、肺间质病、肝炎和光敏感性。其他，如溶血性贫血、巨细胞性贫血、高铁血红蛋白症、光过敏反应（红斑、溃疡、大疱疹和表皮坏死）、琥珀色或黄绿色尿、黄疸、肝性脑病、肝坏死、高血糖、糖尿病恶化、恶性男性乳房瘤、肝功能紊乱、血尿素氮升高、血肌酐升高、血清睾酮反馈性升高、心悸。

【用法与用量】口服：单一用药或与LHRH激动药联合用药的推荐剂量为一日3次，间隔8小时，一次250 mg。与LHRH激动药联合用药时，两者可同时开始使用，或者在开始使用LHRH激动药前24小时使用本品。治疗局限性前列

腺癌症的推荐剂量为一日 3 次，间隔 8 小时，一次 250 mg。如果还使用 LHRH 激动药，本品应与 LHRH 激动药同时用药或提前 24 小时用药。本品必须在放疗前 8 周开始使用，且在放疗期间持续使用。

【制剂与规格】氟他胺片：250 mg。

10.3.2.4 黄体生成素释放激素类

促黄体生成素释放激素类似物（luteinizing hormone releasing hormone analog，LHRHa）包括戈舍瑞林、曲普瑞林和亮丙瑞林。该类药主要作用于垂体 - 性腺轴，通过负反馈机制抑制垂体促性腺激素释放激素（gonadot ropin-releasing hormone，GnRH），又称促黄体生成激素释放激素（luteinizing hormone，releasing hormone，LHRH）的生成和释放，导致垂体分泌促黄体生成素（luteinizing hormone，LH）和促卵泡激素（follicle-stimulating hormone，FSH）的水平下降，进而抑制睾丸和卵巢生成睾酮和雌二醇。通过长期应用 LHRHa 而使男性血清中睾酮和女性血清中雌二醇水平维持在手术去势后的水平，这种药物作用是可逆的。可暂时增加男性血清睾酮和女性血清雌二醇的浓度，而使性激素依赖性的癌症出现“暂时恶化”，继而通过负反馈抑制脑垂体 LH 和 FSH 的合成，血清 LH 和 FSH 水平降低，从而降低睾酮和雌二醇的生成，该类药可用于绝经前及围绝经期晚期乳腺癌的治疗，以及前列腺癌的治疗。

10.3.3 生物反应调节药

生物反应调节药（biological response modifiers，BRMs）是一类具有广泛生物学活性和抗肿瘤活性的生物制剂，既包括一大类天然产生的生物物质，又包括能改变体内宿主和肿瘤平衡状态的方法和手段。根据 BRMs 的定义，这些物质包括对机体免疫功能有增强作用、调节作用及能恢复、重建免疫功能的药物，多种细胞因子如淋巴因子、单核因子、肿瘤生长抑制因子和胸腺因子等；免疫活性细胞如细胞毒性 T 淋巴细胞、淋巴因子激活的杀伤细胞（LAK 细胞），细胞因子激活的肿瘤浸润淋巴（TIL）细胞等；单克隆抗体药物、某些非特异性刺激物质如预防结核的卡介苗、短小棒状杆菌等；还有化学合成类药物如左旋咪唑等。此外，某些中药、多糖类（如香菇多糖、云芝多糖等）及微量元素也能增强免疫功能，均可作为免疫调节药。

虽然抗肿瘤 BRMs 作用机制多种多样，但不外乎两大方面，即通过干扰细胞生长、转化或转移的直接抗瘤作用或通过激活免疫系统的效应细胞及其所分泌的因子来达到对肿瘤杀伤或抑制的目的。

自从基因工程技术在生物医学领域中大规模发展使用后，细胞因子是应用最广泛、疗效最明确的一类 BRMs。近年来临床应用较多的细胞因子主要包括干扰素（IFN-α、IFN-β、IFN-γ）、白介素 -2（IL-2）、造血刺激因子（EPO、TPO、G-CSF、GM-CSF 等）、肿瘤坏死因子（TNF-α）、胸腺素类等。

细胞因子是一类由活化的免疫细胞（单核／巨噬细胞、T 细胞、B 细胞、NK 细胞等）或间质细胞（血管内皮细胞、表皮细胞、成纤维细胞等）所合成、分泌，具有调节细胞生长、分化成熟、调节免疫应答、参与炎症反应、促进创伤愈合和参与肿瘤消长等功能的小分子多肽类活性分子。各类细胞因子在抗肿瘤作用中虽然机制有所不同，但不是孤立行动的。它们相互间有一定的关系和影响，形成了细胞因子网络。细胞因子在抗肿瘤作用中与其他 BRMs 可能存在协同作用。

干扰素直接抗病毒作用，增强主要组织相容性抗原复合物（MHC）和肿瘤相关抗原（TAA）的表达，增强自然杀伤细胞（NK）的细胞毒作用，增强抗体依赖性细胞的细胞毒（ADCC）作用，直接的抗细胞增殖作用和抗血管生成作用等。

白介素 -2（IL-2）可作用于 IL-2 受体而发挥作用。在免疫活性方面能诱导及增强杀伤（NK）细胞的活力；能诱导及增强依赖 IL-2 而获得对自身肿瘤具有细胞毒样活力的杀伤细胞（淋巴因子活化的杀伤细胞，lymphokine-activated killer cells，简称 LAK 细胞）；诱导及增强杀伤性 T 细胞、单核细胞、巨噬细胞的活力；增强 B 淋巴细胞的增殖及抗体分泌；增加依赖抗体细胞毒杀能力。

胸腺素可使由骨髓产生的干细胞转变成T细胞，因而有增细胞免疫功能的作用，对体液免疫的影响甚微。

人体生理平衡是通过神经、免疫、内分泌（NIE）系统形成交叉网络来共同协调维持的，它们除了各自独具的经典内容外，共同担负着控制机体内基本生命活动的重要作用。外源性给予人体抗肿瘤BRMs与免疫系统、内分泌系统、神经系统等药物相互作用，在发挥抗肿瘤效应的同时，由于打破了人体本身生理平衡，必然产生一些相应不良反应。基因重组细胞因子是临床最常用的抗肿瘤BRMs，细胞因子网络与NIE网络的相互联系和影响，是细胞因子不良反应发生的理论基础。充分理解它们之间的相互影响，对BRMs特别是细胞因子不良反应的预防、治疗，以及制订更加合理的治疗方案，有着非常重要的实际意义。这些不良反应可能涉及人体的各个系统，与传统细胞毒化疗相比，可能这些不良反应也许相对较轻，但同样可以导致致命的不良反应。

严重不良反应：①过敏性休克或有血压下降、气管痉挛、呼吸困难的中重度过敏反应；②血管渗漏综合征，大剂量应用干扰素和白介素-2时可出现，表现为体液潴留、心律失常、呼吸困难等；③细胞因子释放综合征，严重的细胞因子释放综合征以呼吸困难（常伴支气管痉挛和低氧血症）、发热（可能出现高热惊厥）、寒战、荨麻疹和血管性水肿为特征。

流感样综合征为生物制剂特别是细胞因子最常见的不良反应，主要表现为发热、寒战、心动过速、头痛、关节痛、乏力不适等。其中干扰素和白介素-2发热更多见，常伴畏寒、寒战，体温可升至38～39℃，24小时内自然消退。流感样症状的反应强度与药物的类型、剂量、给药途径及患者年龄有关。

消化系统反应，常见食欲减退、恶心、呕吐、腹泻；部分患者可出现AST及ALT升高。

神经系统反应中，疲劳常见，少数患者可出现短暂的感觉异常、嗜睡、失眠、眩晕、注意力不集中、定向障碍，偶见抑郁、焦虑、癫痫发作、昏迷。

血液系统反应中，常见的为粒细胞减少及血小板计数减少、少数可伴有轻度贫血、减少剂量或停药后可迅速逆转。

泌尿系统反应中，少数患者可出现暂时性尿蛋白排泄增加，偶可出现可逆性的肾功能不全和肾病综合征。

心血管系统反应中，少见，可出现心动过速、期前收缩、低血压或高血压，偶可出现心房颤动、充血性心力衰竭、脑血管意外。

内分泌系统反应中，偶见甲状腺功能异常、高血糖、低血钠，偶见高血钾、低血钙。

皮肤反应中，局部疼痛、硬结，长期应用少数患者出现脱发、偶见皮疹。

免疫系统反应中，部分患者可能产生自身抗体，可能引起自身免疫性疾病。

由于有过敏反应的发生，用药过程中应严密观察，及时发现和处理；生物制剂不良反应可随着应用时间延长可逐渐耐受或消失；为预防或减轻不良反应发生，应注意用量，如反应过重应减量，甚至停止应用，另可采取间断给药。首次用药出现发热患者，再次给药时可预防给予解热镇痛药如吲哚美辛栓，用对乙酰氨基酚、阿司匹林、吲哚美辛或糖皮质激素可控制流感样症状；大剂量给药时，最好采用心电监护，以防止低血压和心律失常。胸腺素类药物如说明书要求皮试，则注射前或停药后再次注射时须做皮试。该药或同类药物有过敏史的患者禁忌使用，如出现急性过敏反应，应立即停药。妊娠期妇女、哺乳期妇女及18岁以下患者慎用，除非适应证特殊说明。严重肾、肝及骨髓功能不全者，严重心脏病患者忌用，有中枢神经系统疾病者慎用。

胸腺素 α_1 [保(乙)]

Thymosin Alpha-1

【适应证】(1) 慢性乙型肝炎。本品是用来治疗那些18岁或以上的慢性乙型肝炎患者，患者的肝病有代偿性，和有乙型肝炎病毒复制（血清HBV-DNA阳性），在那些血清乙肝表面抗原（HBsAg）阳性最少6个月，且有ALT升高的患者所作之研究显示，本品治疗可以产生病毒性

缓解（血清HBV-DNA失去）和ALT水平复常。在一些做出应答的患者，本品治疗可除去血清表面抗原。本品与α干扰素联用时可能比单用本品或单用干扰素增加应答率。（2）作为免疫损害患者的疫苗增强剂。免疫系统功能受到抑制者，包括接受慢性血液透析和老年病患者，本品增强患者对病毒性疫苗，例如流感疫苗或乙肝疫苗的免疫应答。血液透析患者在接种流感疫苗后，应用本品作为佐剂者有65%患者产生抗流感病毒抗体，滴度水平增高4倍以上，安慰剂组只有24%患者做出此反应。

【注意事项】（1）下列情况慎用，如对其他胸腺制剂过敏和应用皮质激素类药物。（2）在用药期间，慢性肝炎患者应每月复查肝功能。

【禁忌证】本品禁用于那些有对胸腺素 α_1 或注射液内任何成分有过敏历史的患者；做免疫抑制的患者（如器官移植受者）禁用，除非治疗带来的好处明显优于危险；正在使用免疫抑制药的患者；本品只能在真正需要时给予妊娠期妇女使用，哺乳期妇女慎用。

【不良反应】可见注射部位疼痛、红肿、短暂性肌肉萎缩、多关节痛伴水肿、皮疹、荨麻疹、发热、头晕，慢性乙肝患者接受本品治疗时，可有ALT有一过性上升到基础值的2倍（ALT波动）以上，当ALT波动发生时本品通常应继续使用，除非有肝衰竭的症状和预兆出现。

【用法与用量】本品不应做肌内注射或静脉注射。应使用随盒的1.0 ml注射用水溶解后马上皮下注射。本品治疗慢性乙肝的推荐量是1.6 mg皮下注射，一周2次，两剂量相隔3～4日。治疗应连续6个月期间不可中断。假如本品与α干扰素联合使用，应参考α干扰素处方资料内的剂量和注意事项。在联合应用的临床试验上，当两药物在同一日使用时，本品一般是早上给药而干扰素是晚上给药。本品作为病毒性疫苗增强剂使用，推荐剂量是1.6 mg皮下注射，一周2次，一次相隔3～4日。疗程应持续4周，第一针应在接种疫苗后马上给予。医师决定是否教导患者自行注射。

【制剂与规格】注射用胸腺素 α_1：1.6 mg。

白细胞介素-2[保(乙)]

Interleukin-2

【适应证】（1）用于肾细胞癌、黑色素瘤、乳腺癌、膀胱癌、肝癌、直肠癌、淋巴癌、肺癌等恶性肿瘤的治疗，癌性胸腹水的控制，淋巴因子激活的杀伤细胞的培养。（2）用于手术、放疗及化疗后的肿瘤患者的治疗，可增强机体免疫功能。（3）用于先天或后天免疫缺陷症的治疗，提高患者细胞免疫功能和抗感染能力。（4）各种自身免疫病的治疗，如类风湿关节炎、系统性红斑狼疮、舍格伦综合征等。（5）对某些病毒性、杆菌性疾病、胞内寄生菌感染性疾病，如乙型肝炎、麻风病、肺结核、白色念珠菌感染等具有一定的治疗作用。

【注意事项】（1）本品必须在有经验的专科医师指导下慎重使用。（2）下列情况慎用：妊娠及哺乳期妇女、儿童、有严重心脑肾等并发症的老年人。（3）药瓶有裂缝、破损者不能使用。本品加0.9%氯化钠注射液溶解后为透明液体，如遇有浑浊、沉淀等现象，不宜使用。药瓶开启后，应一次用毕，不得多次使用。（4）使用本品应从小剂量开始，逐渐增大剂量。应严格掌握安全剂量。使用本品低剂量、长疗程可降低毒性，并且可维持抗肿瘤活性。（5）药物过量可引起毛细血管渗漏综合征，表现为低血压、末梢水肿、暂时性肾功能不全等，应立即停用，对症处理。

【禁忌证】对本品成分有过敏史的患者。高热、严重心脏病、低血压者，严重心肾功能不全者，肺功能异常或进行过器官移植者。重组人白介素-2既往用药史中出现过与之相关的毒性反应：包括持续性室性心动过速；未控制的心律失常；胸痛并伴有心电图改变、心绞痛或心肌梗死；肾衰竭需透析＞72小时；昏迷或中毒性精神病＞48小时；顽固性或难治性癫痫；肠局部缺血或穿孔；消化道出血需外科手术。

【不良反应】常见发热、寒战，与用药剂量有关，一般是一过性发热（38℃左

右)，亦可有寒战高热，停药后 3 ~ 4 小时体温多可自行恢复到正常；恶心、呕吐、类感冒症状；皮下注射者局部可出现红肿、硬结、疼痛，所有不良反应停药后均可自行恢复；使用较大剂量时，本品可引起毛细血管渗漏综合征，表现为低血压，末梢水肿、暂时性肾功能不全等；使用本品应严格掌握安全剂量，并对症治疗；为减轻寒战和发热，可于 IL-2 应用前 1 小时肌内注射异丙嗪 25 mg 或口服对乙酰氨基酚 0.5 g，吲哚美辛 25 mg，最多一日可服用 3 次；皮疹和瘙痒可用抗组胺药治疗；呕吐可用止吐药对症治疗。严重低血压可用多巴胺等升压药。

【用法与用量】用灭菌注射用水溶解，具体用法、剂量和疗程因病而异，一般采用下述几种方法（或遵医嘱）。(1) 皮下注射：重组人白介素 -2 (125Ala) 60 万 ~ 100 万 U/m^2 加 2 ml 注射用水溶解，皮下注射一周 3 次，6 周为 1 个疗程。(2) 静脉注射：40 万 ~ 80 万 U/m^2 加 0.9% 氯化钠注射液 500 ml，滴注时间不少于 4 小时，一周 3 次，6 周为 1 个疗程。(3) 介入动脉灌注：50 万 ~ 100 万 U/ 次，2 ~ 4 周一次，2 ~ 4 次为 1 个疗程。(4) 区域与局部给药：①胸腔注入，用于癌性胸腔积液，重组人白介素 -2 (125Ala) 一次 100 万 ~ 200 万 U/m^2，尽量抽去腔内积液后注入，一周 1 ~ 2 次，2 ~ 4 周（或积液消失）为 1 个疗程。②肿瘤病灶局部给药，根据瘤体大小决定用药剂量，一次用量不少于 10 万 U，隔日一次，4 ~ 6 次为 1 个疗程。

【制剂与规格】注射用重组人白介素 -2：① 10 万 U；② 20 万 U；③ 50 万 U；④ 100 万 U；⑤ 150 万 U；⑥ 200 万 U。

重组人白介素 -11 [保 (乙)] (Ⅰ)

Recombinant Human Interleukin-11 (Ⅰ)

【适应证】用于实体瘤、非髓系白血病化疗后Ⅲ、Ⅳ度血小板减少症（血小板计数 ≤ 50 × 10^9/L）的治疗，以减少患者因血小板减少引起的出血和对血小板输注的依赖性。

【注意事项】(1) 同时有白细胞减少症的患者必要时可联合应用粒细胞集落刺激因子。(2) 肿瘤化疗患者应在化疗后使用，不宜在化疗前或化疗中使用。(3) 对器质性心脏病患者，如冠心病、不稳定型心绞痛，尤其是充血性心力衰竭及心房纤颤、心房扑动病史的患者，以及高血压、高凝状态和严重脑血管疾病患者慎用。对在治疗中出现心悸、心律失常等症状患者，应注意进行心肌损伤指标的生化检测分析。(4) 使用期间应注意毛细血管渗漏综合征的监测，如体重增加、水肿、浆膜腔积液等。(5) 妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对重组人白介素 -11 及本品中其他成分过敏者、对血液制品和大肠埃希菌表达的其他生物制剂者有过敏史者禁用。

【不良反应】常见乏力、恶心、呕吐、发热、肌肉疼痛、头痛、关节痛、面部和四肢水肿、心悸、气短、结膜充血、视物模糊；少见过敏、皮炎、咽炎、声音嘶哑、腹泻、腹胀、头晕、面部潮红、干咳、咯血、精神恍惚等。

【用法与用量】皮下注射：推荐剂量为一次 25 μg/kg，一日 1 次，溶于注射用水 2 ml，于化疗结束后 24 ~ 48 小时开始或发生血小板减少症后注射，疗程一般为 10 日，于血小板计数恢复正常后应及时停药。

【制剂与规格】注射用重组白介素 -11：1.5 mg。

干扰素 α_{1b} [保 (乙)]

Interferon α_{1b}

【适应证】治疗病毒性疾病和某些恶性肿瘤。主要使用于治疗慢性乙型肝炎、慢性丙型肝炎和毛细胞白血病等。对尖锐湿疣、慢性宫颈炎、疱疹性角膜炎、带状疱疹、流行性出血热和小儿呼吸道合胞病毒性肺炎等病毒性疾病均有效。对其他病毒性疾病和恶性肿瘤如慢性粒细胞白血病、黑色素瘤、淋巴瘤等也有良好疗效。

【注意事项】(1) 过敏体质，特别是对抗生素有过敏者，本品应慎用。在使用过程中如发生过敏反应，应立即停药，并给予相应治疗。(2) 妊娠及哺乳期妇女应慎用，在病情十分需要时，由医师指导使

用。(3) 本品治疗儿童病毒性肝炎是可行的。推荐采用渐进式治疗，从小剂量逐步过渡到正常治疗剂量，近期不良反应可明显减少、减轻。应在儿科医师严密观察下使用。(4) 本品可在老年患者中应用，但患有禁忌证的例外。对年老体衰耐受不了可能发生的不良反应者应十分谨慎，应在医师严密观察下应用。当使用较大剂量尤应谨慎，必要时可先用小剂量，逐渐加大剂量可以减少不良反应。(5) 使用前应仔细检查瓶壁或注射器，如瓶或瓶塞或注射器有裂缝、破损不可使用，溶液如有浑浊或沉淀等异常现象亦不可使用。(6) 本品不含防腐剂，因此任何已开启的药瓶或注射器，应一次用完，不得分次使用。

【禁忌证】已知对干扰素制品过敏者；有心绞痛、心肌梗死病史以及其他严重心血管病史者；有其他严重疾病不能耐受本品的不良反应者；癫痫和其他中枢神经系统功能紊乱者；有间质性肺炎病史患者。

【不良反应】可见发热、疲乏、头痛、肌痛、关节痛、食欲减退、恶心、粒细胞计数减少、血小板减少等。如出现上述患者不能耐受的严重不良反应时，应减少剂量或停药，并给予必要的对症治疗。另可能有间质性肺炎发生。

【用法与用量】本品可以直接肌内、皮下注射和病灶注射。(1) 慢性乙型肝炎：一次 30 ~ 50 μg，一日 1 次，连续 4 周后改为隔日 1 次，疗程 4 ~ 6 个月，可根据病情延长疗程至 1 年。(2) 慢性丙型肝炎：一次 30 ~ 50 μg，一日 1 次，连续 4 周后改为隔日 1 次，疗程 4 ~ 6 个月，无效者停用。有效者可继续治疗至 12 个月。根据病情需要，可延长至 18 个月。疗程结束后随访 6 ~ 12 个月。急性丙型肝炎应早期使用本品治疗，可减少慢性化。(3) 慢性粒细胞性白血病：一次 10 ~ 30 μg，一日 1 次，皮下或肌内注射，第 2 周后改为一次 30 ~ 50 μg，一日 1 次，皮下或肌内注射，连续用药 6 个月。可根据病情适当调整，缓解后可改为隔日注射。(4) 毛细胞白血病：本品一次 30 ~ 50 μg，一日 1 次，连续用药 6 个月以上，可根据病情适当调整，缓解后可改为隔日注射。(5) 尖锐湿疣：一次 10 ~ 50 μg，均匀注射于各患处基底部，隔日 1 次，连续 3 ~ 6 周。不能采用此法时可行肌内注射。可根据病情延长或重复疗程。(6) 肿瘤：视病情可延长疗程。开始时可皮下或肌内注射一次 30 ~ 50 μg，一日或隔日注射。如患者未出现病情迅速恶化或严重不良反应，应在适当剂量下继续用药。

【制剂与规格】重组人干扰素 α_{1b} 注射液：① 0.5 ml : 6 μg；② 0.5ml : 10 μg；③ 0.5 ml : 20 μg；④ 1 ml : 10 μg；⑤ 1 ml : 30 μg；⑥ 1 ml : 40 μg；⑦ 1 ml : 50 μg。

干扰素 γ

Interferon γ

【适应证】类风湿关节炎，肝纤维化。

【注意事项】(1) 凡有明显过敏体质，特别是对抗生素有过敏史者应慎用，必须使用时应先用本品做皮肤试验（5 000 U 皮内注射），阴性者方可使用。在使用过程中如发生过敏反应应立即停药，并给予相应治疗。(2) 对妊娠及哺乳期妇女、年老体衰者应慎重考虑是否能耐受本品可能发生的不良反应，应在医师严密观察下谨慎使用。必要时可先用小剂量，然后逐渐加大剂量可减少不良反应。(3) 儿童（特别是幼龄儿童）应在儿科医师严密观察下谨慎使用。(4) 使用前应仔细检查西林瓶，如有裂缝、破损不能使用。在加入灭菌注射用水后稍加震荡，制品应溶解良好，如有不能溶解的块状或絮状物时，不得使用。(5) 每瓶制品用灭菌注射用水 1 ml 溶解，溶解后应一次用完，不得分次或给第二人使用。(6) 本品应在临床医师指导下使用。

【禁忌证】对干扰素、大肠埃希菌来源的制品过敏者；有心绞痛、心肌梗死史及其他严重心血管病史者；有其他严重疾病而不能耐受本品可能出现的不良反应者；癫痫和其他中枢神经系统功能紊乱者；有间质性肺炎病史患者。

【不良反应】发热常在开始用药阶段发生，在注射后 3 ~ 4 小时后出现，多数为低热（38℃以下），仅少数在 38℃以上，持续数小时自行消退；一般用药 2 ~ 4 日后即不再有发热反应；疲劳、不适、头痛、肌痛、关节痛、食欲减退、恶心；粒细胞计数减少、血小板减少、一般为一过性和

可逆性，能自行恢复。如出现上述患者不能忍受的严重不良反应时应减少剂量或停药，并给予对症治疗。可能有间质性肺炎发生。

【用法与用量】皮下或肌内注射：①用于类风湿关节炎，每瓶制品用灭菌注射用水 1 ml 溶解开始一日肌内注射 50 万 U，连续 3 ~ 4 日后，如无明显不良反应，将剂量增到一日 100 万 U，第 2 个月开始改为隔日 150 万 ~ 200 万 U 肌内注射，总疗程 3 个月。②用于肝纤维化，每瓶制品用灭菌注射用水 1 ml 溶解，皮下或肌内注射。前 3 个月，一日注射 100 万 U；后 6 个月，隔日注射 100 万 U，总疗程 9 个月。

【制剂与规格】注射用重组人干扰素 γ：① 100 万 U；② 200 万 U。

乌苯美司 [保（乙）]

Ubenimex

【适应证】可增强免疫功能，用于抗癌化疗、放疗的辅助治疗，老年性免疫功能缺陷等。可配合化疗、放疗及联合应用于白血病、多发性骨髓瘤、骨髓增生异常综合征及造血干细胞移植后，以及其他实体瘤患者。

【注意事项】本品日剂量不宜超过 200 mg，以避免 T 细胞减少。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女慎用。

【不良反应】偶见皮疹、瘙痒、头痛、面部水肿和一些消化道反应，如恶心、呕吐、腹泻、软便；个别可出现一过性轻度 AST 升高。一般在口服过程中或停药后消失。

【用法与剂量】口服：成人一日 30 mg，1 次于早晨空腹口服或分 3 次口服；儿童酌减。症状减轻或长期服用，也可每周服用 2 ~ 3 次，10 个月为 1 个疗程。

【制剂与规格】乌苯美司胶囊：10 mg。

草分枝杆菌 F.U.36 [保（乙）]

Mycobacterium Phlei F.U.36

【适应证】用于肺和肺外结核病及其他免疫功能低下性疾病。

【注意事项】(1) 发热患者禁用，虚弱患者慎用。(2) 本品同其他药物及疫苗是相容的（疫苗注射后间隔 2 周再注射本品为佳），与抗生素、抗结核药、口服降糖药配伍使用，从疗效看有协同作用。(3) 同时使用免疫抑制药物，会降低本品药效。(4) 使用前摇匀。(5) 注意注射部位，可选择臀部的上外侧用 50 mm 或 60 mm 注射针进行深部肌内注射。每次注射前应认真观察注射部位症状，如出现红肿、硬结应暂停注射，待红肿、硬结、疼痛消失后再注射。

【不良反应】本品耐受性好，偶见注射部位发红，但较快可消失，此种反应可能是药效反应。注射后 2 ~ 3 日偶见出现疲倦、痰多，在局部或在病灶的皮肤部位有轻微疼痛并伴轻微烧灼感，特别是注射方法不当会加重此不良反应。

【用法与用量】深部肌内注射：一次 1.72 μg，一周 1 次，一般 10 次为 1 个疗程。

【制剂与规格】草分枝杆菌 F.U.36 注射液：1 ml ∶ 1.72 μg（以草分枝杆菌 F.U.36 干重计）。

10.3.4 靶向治疗

10.3.4.1 单克隆抗体药

单抗药物是以肿瘤细胞或肿瘤微环境中特定的受体或基因表达产物作为靶点的一类新型药物，单抗类药物具有高度特异性，可在体内靶向性分布，选择性杀伤特定细胞。

单抗能特异性地与靶细胞表面或循环中的配体结合，影响与该配体相关的功能，通常是与靶细胞的增殖、凋亡等相关，能与细胞表面分子受体结合的单抗都有一个共有的作用机制，即补体依赖的细胞毒作用和抗体依赖细胞的细胞毒作用杀伤肿瘤细胞，诱导肿瘤细胞凋亡和提高肿瘤细胞对化疗的敏感性也是其重要的作用机制。曲妥珠单抗、利妥昔单抗、西妥昔单抗主要通过上述机制发挥作用，贝伐单抗作用机制较为特殊，主要通过与循环中血管内皮生长因子（VEGF）结合，阻碍 VEGF 与其受体在内皮细胞表面药物相互作用而起作用。早期的单抗类药物多是由基因工程方法获得的人鼠嵌合型的单克隆抗体药物，由于鼠源蛋白的存在，多次使用可能导致抗体出现。

抗肿瘤单克隆抗体的不良反应

单抗类药物较细胞毒化疗药品不良反应轻，无明显胃肠道及骨髓毒性，但同样可以导致致命的不良反应。

（1）过敏反应：单抗类药物为大分子蛋白质，静脉滴注蛋白可导致患者发生过敏样反应或其他超敏反应。轻 - 中度过敏反应表现为发热、寒战、头痛、皮疹等，少数患者可发生严重过敏反应，出现血压下降、气管痉挛、呼吸困难等。过敏反应大多数发生在第一次用药时，尤其是首次剂量较高时。典型的超敏反应常于开始滴注的几分钟内发生，也可发生在滴注后 30 ~ 120 分钟。而在以后再用药时会较少发生过敏反应。为预防过敏反应发生，一般在开始治疗前 30 ~ 60 分钟给予解热镇痛药和抗组胺药，也可考虑应用糖皮质激素。首次用药开始时应缓慢输注，并密切观察呼吸、血压、心率、体温等。不能静脉注射或通过其他途径给药。

如出现轻度过敏反应，可不必停药，减慢输注速度或暂停输注多可缓解，缓解后再继续用药，须密切观察。发生严重过敏反应时必须立即永久停药，并立即使用肾上腺素、抗组胺药和皮质激素等，缓解后应延长足够的监护时间。

（2）细胞因子释放综合征：淋巴瘤患者循环中有大量恶性肿瘤细胞（> 25 000 个 /ml）或高肿瘤负荷（病灶 >10 cm）者，发生严重的细胞因子释放综合征或肿瘤溶解综合征的风险较高，使用利妥昔单抗时应极其慎重。应该考虑进行预治疗以降低肿瘤负荷。这类患者在第一次滴注利妥昔单抗时应考虑减慢滴注速度。

肺功能不全或高肿瘤负荷者出现严重的细胞因子释放综合征或肿瘤溶解综合征的风险增加。这些反应在临床上可能与超敏反应无法区别。严重的细胞因子释放综合征以严重的呼吸困难（常伴支气管痉挛和低氧血症）、发热（可能出现高热惊厥）、寒战、荨麻疹和血管性水肿为特征。还可伴随出现一些肿瘤溶解综合征的特征，如高尿酸血症、高钾血症、低钙血症、LDH 升高、急性肾衰竭危及生命的呼吸衰竭。

急性呼吸衰竭可伴有胸部 X 线可见的肺间质浸润和水肿。出现严重细胞因子释放综合征的患者应立即停止滴注，并给予积极的对症治疗。

少数患者在临床症状开始好转后再次出现恶化，所以应严密监护这些患者，直至症状和体征完全消失。在症状和体征完全消退后对患者继续进行治疗，很少导致严重的输液相关反应。

（3）皮肤及皮下组织不良反应：西妥昔单抗治疗的患者 80% 以上的患者可能发生皮肤反应，其中约 15% 症状严重。主要症状为粉刺样皮疹，其次为指甲病（如甲床炎），其他包括皮肤干燥、皲裂，以及炎症和感染性后遗症，如睑炎、唇炎、蜂窝织炎等。这些不良反应大多在治疗的第 1 周内出现。通常中断治疗后上述症状可以自行消退，并无后遗症。随后可以按照推荐的调整剂量继续进行治疗。

患者发生严重的皮肤反应必须中断治疗。只有当皮肤反应恢复到 2 级，才能重新进行治疗。如严重的皮肤反应属首次发生，不需要调整药物的剂量。如严重的皮肤反应为第 2 次或第 3 次出现，必须再次中断使用本品。只有当反应缓解到 2 级，才能重新开始以较低剂量继续进行治疗。如严重的皮肤反应为第 4 次发生，或停药后皮肤反应无法缓解至 2 级，则须永久停止应用本品进行治疗。

（4）心脏毒性：在单独使用曲妥珠单抗治疗的患者中，中至重度心力衰竭的发生率为 5%。在与化疗联合的随机临床试验中，中至重度的心力衰竭的发生率为 16%，而不加曲妥珠单抗治疗的患者中发生率仅为 3%。

在使用曲妥珠单抗治疗的患者中应密切观察有无心脏功能减退的症状和体征与曲妥珠单抗治疗相关的充血性心力衰竭可能相当严重，并可引起致命性心力衰竭、死亡、黏液栓子脑栓塞。

目前尚无数据显示有合适的评价方法可确定患者有发生心脏毒性危险。在本品治疗过程中，左心室功能应经常评估。若患者出现临床显著的左心室功能减退应考虑停用曲妥珠单抗。

约 2/3 有心功能减退的患者有症状，大多数治疗后症状好转。治疗通常包括利尿药、强心苷类药、血管紧张素转换酶抑

制药类药。

(5) 胃肠道穿孔／伤口愈合并发症：使用贝伐单抗可并发胃肠道穿孔和伤口开裂，有时甚至是致命的。胃肠穿孔，有时伴有腹腔内脓肿，可发生在应用贝伐单抗的全过程（但和使用时间的长短没有相关性）。典型的表现为腹痛、伴有便秘或呕吐等症状。在应用贝伐单抗的过程中，如果患者出现腹痛、应考虑胃肠穿孔的诊断。

如果患者在应用贝伐单抗的过程中出现胃肠穿孔或需要医疗干预的伤口开裂，应永久停用贝伐单抗。为了避免贝伐单抗治疗影响伤口愈合／伤口开裂，在应用贝伐单抗治疗结束后要间隔多长时间再进行选择性手术，目前还没有定论，一般要求术后至少 28 日才能开始贝伐单抗治疗，术前 28 日内不能应用贝伐单抗。

(6) 出血：在接受贝伐单抗治疗的患者中，出现两种不同的出血情况。最常见的是轻微的出血，主要表现为鼻出血；另一种是严重的肺出血，有时是致命的。

在一项采用贝伐单抗和化疗联合治疗非小细胞肺癌的研究中发现，病理组织学为鳞癌的严重或致命出血发生率为 31%，而腺癌的发生率仅为 4%，但单独采用化疗的无一例发生。

不常见的严重出血包括胃肠道出血、蛛网膜下腔出血和出血性休克。

患者如果出现需要医疗干预的严重出血，应马上停用贝伐单抗并给予积极的医疗处理。近期发生过出血的患者不应接受贝伐单抗治疗。

(7) 高血压：接受贝伐单抗治疗的患者中，高血压和严重高血压的发生率均有升高。在发生严重高血压的患者中，有 51% 的患者舒张压超过 110 mmHg，而收缩压＜ 200 mmHg。需要使用血管紧张素转换酶抑制药、β 受体拮抗药、利尿药、钙通道阻滞药。在停用治疗 4 个月后，仍有患者有持续性的高血压。

出现高血压危象的患者，贝伐单抗要长期停用。对于没有得到控制的严重高血压，建议贝伐单抗应暂时停用。

(8) 肾病综合征：接受化疗联合贝伐单抗治疗的患者中，蛋白尿的发生率和严重性均有升高。在停用贝伐单抗几个月后蛋白尿仍可异常。

有肾病综合征的患者应停用贝伐单抗。中到重度蛋白尿患者使用贝伐单抗的安全性，目前还没定论。但在大多数的临床研究中，当 24 小时蛋白尿≥ 2 g 时，即应停用贝伐单抗。

(9) 注意事项：①妊娠。已知免疫球蛋白 IgG 可通过胎盘屏障，所以除非可能给患者带来的益处大于潜在的危险，单抗类药物不应用于妊娠期妇女。育龄期妇女在使用单抗的过程中及治疗后的 12 个月，应采取有效的避孕措施。②哺乳。已知母体的 IgG 可进入乳汁，建议哺乳期妇女在使用单抗类药物治疗期间和最后 1 次用药后 1 个月内不要哺乳。③儿童用药。单抗类药物应用于儿童的有效性和安全性尚未确定。④老年患者用药。老年患者无需调整剂量。

利妥昔单抗

Rituximab

【适应证】复发或耐药的滤泡性中央型淋巴瘤（国际工作分类 B、C 和 D 亚型的 B 细胞非霍奇金淋巴瘤）。未经治疗的 CD20 阳性Ⅲ～Ⅳ期滤泡性非霍奇金淋巴瘤，应与标准 CVP 化疗（环磷酰胺、长春新碱和泼尼松）8 个周期联合治疗。CD20 阳性弥漫大 B 细胞性非霍奇金淋巴瘤（DLBCL），应与标准 CHOP 化疗（环磷酰胺、多柔比星、长春新碱、泼尼松）8 个周期联合治疗。

【注意事项】(1) 细胞因子释放综合征或肿瘤溶解综合征。出现严重细胞因子释放综合征的患者应立即停止滴注，并予对症治疗，严密监护至症状和体征消失。(2) 超敏反应。(3) 约 50% 的患者会出现输液相关不良反应，约 10% 的患者较严重，出现低血压、呼吸困难和支气管痉挛。(4) 滴注期间可能出现一过性低血压，滴注前 12 小时及滴注期间应考虑停用抗高血压药。有心脏病史的患者在滴注过程中应严密监护。(5) 可能导致严重的皮肤黏膜反应。(6) 定期检查全血细胞计数。骨髓功能差的患者慎用。

【禁忌证】对本品的任何组分和鼠蛋白过敏者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见疼痛、全身不适、腹胀、腹泻、消化不良、厌食症、淋巴结病高血压、心动过缓、心动过速、直立性低血压、心律失常、高血糖、外周水肿、LDH 增高、低钙血、肌张力增高、头晕、焦虑、感觉异常、激惹、失眠、神经质、咳嗽、鼻窦炎、支气管炎、呼吸道疾病、阻塞性细支气管炎、出汗、单纯疱疹、带状疱疹、泪液分泌疾病、结膜炎及味觉障碍。

【用法与用量】须稀释后静脉滴注。无菌条件下，用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液稀释到浓度为 1 mg/ml，通过专用输液管给药。初次滴注，起始滴注速度每小时 50 mg；最初 60 分钟过后，可每 30 分钟增加每小时 50 mg，直至最大速度每小时 400 mg。以后的滴注，起始滴注速度可为每小时 100 mg，每 30 分钟增加每小时 100 mg，直至最大速度每小时 400 mg。用于滤泡性非霍奇金淋巴瘤，单药治疗，成人一次 375 mg/m^2，一周 1 次，22 日疗程内共给药 4 次。首次治疗后复发患者，一次 375 mg/m^2，一周 1 次，连续 4 周。弥漫大 B 细胞性非霍奇金淋巴瘤联合 CHOP，一次 375 mg/m^2，每个化疗周期的第 1 天使用，化疗的其他组分应在本品应用后使用。不推荐本品在治疗期间减量使用，与标准化疗合用时，标准化疗药剂量可以减少。

【制剂与规格】利妥昔单抗注射液：① 10 ml : 100 mg；② 50 ml : 500 mg。

曲妥珠单抗

Trastuzumab

【适应证】HER2 过度表达的转移性乳腺癌、已接受过 1 个或多个化疗方案的转移性乳腺癌、联合紫杉类药物治疗未接受过化疗的转移性乳腺癌。

【注意事项】(1) 须在有经验的医师监测下用药。(2) 观察到有心脏功能症状和体征。与蒽环类药物和环磷酰胺合用时心脏不良事件风险增加。治疗前应进行全面的基础心脏评价，治疗中应评估左心室功能，若出现显著的左心室功能减退应考虑停药。监测并不能全部发现将发生心功能减退的患者。(3) 在灭菌注射水中，苯甲醇作为防腐剂，它对新生儿和 3 岁以下的儿童有毒性。用于对苯甲醇过敏的患者，应用注射用水重新配制。(4) 不能使用 5% 葡萄糖注射液为溶剂，因其可使蛋白凝固，不可与其他药物混合输注。

【禁忌证】对本品或其他成分过敏者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见白细胞计数减少、血小板减少、贫血。(2) 消化系统：可见肝毒性、厌食、便秘、腹泻、消化不良、腹胀、恶心、呕吐。(3) 循环系统：可见周围水肿、心功能不全、血管扩张、低血压。(4) 中枢神经系统：可见焦虑、抑郁、眩晕、失眠、感觉异常、嗜睡、疲乏、寒战、发热、关节痛和肌肉痛。(5) 呼吸系统：可见哮喘、咳嗽增多、感冒样症状、感染、呼吸困难、鼻出血、肺部疾病、胸腔积液、咽炎、鼻炎、鼻窦炎。(6) 皮肤系统：可见瘙痒及皮疹。

【用法与用量】静脉滴注：初次剂量，一次 4 mg/kg，90 分钟内输入。维持剂量，一次 2 mg/kg，一周 1 次，如初次剂量可耐受，则维持剂量可于 30 分钟内输完。治疗持续到疾病进展为止。

【制剂与规格】注射用曲妥珠单抗：440 mg。

西妥昔单抗

Cetuximab

【适应证】与伊立替康合用于治疗过表达 EGFR、经伊立替康治疗失败后的转移性结直肠癌。

【注意事项】(1) 如出现轻中度超敏反应，应减慢本品的滴注速度，一旦发生严重超敏反应，应立即并永久停用，并进行紧急处理。(2) 给药时发生呼吸困难可能与本品相关，老年患者、体能状况低下或伴有肺部疾病的患者可能存在更高的与呼吸困难相关的风险。(3) 发生严重 (3 级) 皮肤反应，须中断治疗。(4) 体能状况低下或伴有心肺疾病的患者慎用。(5) 注意监测血清中镁的水平，需要时应补充镁。(6) 用药过程中及用药结束后 1 小时内，需密切监测患者的状况，并须配备复苏设备。(7) 首次滴注本品之前，患者须接受抗组胺药物治疗，建议在一次使用本

品前都进行这种治疗。(8) 伊立替康须在本品滴注结束1小时后开始使用。(9) 本品须在有经验的医师指导下使用。建议检测EGFR。

【禁忌证】已知对本品有严重超敏反应(3级或4级)者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见急性气道阻塞、支气管痉挛、喘鸣、声音嘶哑、语言困难、风疹、低血压、发热、寒战、恶心、皮疹、结膜炎、呼吸困难、粉刺样皮疹、指甲病、甲床炎、低镁血症。

【用法与用量】静脉滴注：初始剂量一次400 mg/m^2，滴注120分钟，之后一周给药1次250 mg/m^2，滴注60分钟，最大滴注速率不得超过5 ml/min。治疗持续至病情进展。

【制剂与规格】西妥昔单抗注射液：50 ml : 100 mg。

贝伐单抗

Bevacizumab

【适应证】与氟尿嘧啶/叶酸联合或与氟尿嘧啶/叶酸/伊立替康(IFL方案)联合，用于一线治疗转移性结直肠癌、与某些化疗方案联合治疗晚期非小细胞肺癌。

【注意事项】(1) 一旦出现胃肠道穿孔应永久停用。(2) 有影响伤口愈合的潜在危险。(3) 治疗期间应监测血压，出现需要治疗的严重高血压时应暂停治疗，如果出现难以控制的高血压、高血压危象或高血压脑病时，应永久停用。(4) 治疗前及治疗中监测尿蛋白，出现4级蛋白尿(肾病综合征)时应停用。(5) 出现严重的动脉血栓事件应永久停用。(6) 不用于已有中枢神经转移的患者。(7) 曾有使用本品后出血的患者应永久停用。(8) 发生充血性心力衰竭的风险增加，用药时应予关注。(9) 妊娠期妇女应慎用，哺乳期妇女应停止哺乳。

【禁忌证】对活性物质或辅料成分过敏者，对中国仓鼠卵巢细胞产品或其他重组人类或人源抗体过敏者。

【不良反应】可见胃肠道穿孔、出血、动脉血栓、衰弱、腹泻、恶心、疼痛、高血压、蛋白尿、伤口愈合减慢、可逆性后脑白质病综合征(RPLS)、肿瘤相关出血、黏膜皮肤出血、血栓栓塞、充血性心力衰竭、心肌病、中性粒细胞或白细胞计数减少。

【用法与用量】静脉滴注：一次5 mg/kg，14日给药1次。用氯化钠注射液稀释，第一次滴注应在化疗后，时间应超过90分钟。之后给药可在化疗前或化疗后，如耐受性好，滴注时间可缩短。

【制剂与规格】贝伐单抗注射液：① 4 ml : 100 mg；② 16 ml : 400 mg。

10.3.4.2 酪氨酸激酶抑制药

本章节涉及的是口服的小分子受体酪氨酸激酶抑制药，包括吉非替尼、厄罗替尼、索拉非尼和舒尼替尼。吉非替尼和厄罗替尼是针对表皮生长因子受体(epithelial growth factor receptor，EGFR)的小分子受体酪氨酸激酶抑制药，它们的作用机制相似，均通过直接作用于EGFR的细胞内ATP结合位点而抑制其酪氨酸激酶活性，起到阻断信号传导和抑制肿瘤细胞增殖的作用，我国批准的吉非替尼、厄罗替尼适应证为经一个或两个化疗方案失败的局部晚期或转移性非小细胞肺癌。索拉非尼和舒尼替尼则是新颖的多激酶抑制药，同时作用于多个靶点，既有抗血管生成的作用又能直接抑制肿瘤细胞的增殖。索拉非尼还是目前唯一已上市的RAF激酶抑制药。除了共同的适应证即无法手术切除的晚期肾细胞癌外，索拉非尼还被批准用于治疗无法手术切除或转移的肝细胞癌，而舒尼替尼的另一个适应证是经伊马替尼治疗失败的或者不能耐受伊马替尼治疗的转移性胃肠间质瘤(gastrointestinal stroma tumor，GIST)。

酪氨酸激酶抑制药的不良反应

吉非替尼和厄罗替尼的不良反应以皮肤毒性和腹泻最为常见，一般程度较轻。皮肤及其附属物的不良反应包括皮疹、皮肤干燥和指甲异常。皮疹往往为痤疮样，皮疹的严重程度可以预示疗效。轻、中度的皮疹无须特殊处理，可采取避免日晒、涂抹润肤露和含糖皮质激素的软膏，或口服抗过敏药如氯苯那敏、阿司咪唑和氯雷他定等，伴发感染时可局部涂抹抗生素软

膏或口服抗生素处理。腹泻也是最常见的不良反应，中重度腹泻可予口服洛派丁胺，注意同时补充液体和电解质，严重患者短暂停药可迅速缓解症状。

吉非替尼和厄罗替尼治疗期间有发生间质性肺炎的可能。间质性肺炎的发生率很低但可致命，临床现为呼吸困难、咳嗽、低热和血氧饱和度的降低，影像学上往往有肺间质的毛玻璃样改变。治疗过程中应密切监测有无间质性肺病发生的可能性。当新出现难以解释的上述症状时，应进一步检查评价，一旦证实有间质性肺病时，应立即停用，并给予相应的治疗。吉非替尼和厄罗替尼均经肝脏代谢，可以引起无症状的肝转氨酶的升高，治疗中应加以监测。

吉非替尼和厄罗替尼的安全性和药动学在老年患者与年轻人无明显差异，因此应用于老年患者时不建议调整剂量。吉非替尼有治疗儿童脑神经胶质瘤的报告，厄罗替尼缺乏在儿童中的用药经验。

索拉非尼和舒尼替尼的不良反应类型较吉非替尼和厄罗替尼广泛，这与它们的多靶点作用机制有关。熟悉、重视和正确处理不良反应是保障患者安全和疗效的关键。

皮肤毒性和腹泻同样是索拉非尼和舒尼替尼常见的不良反应。索拉非尼和舒尼替尼皮疹的发生率较吉非替尼和厄罗替尼低，但另一个突出的皮肤反应表现为手足皮肤综合征。严重的手足综合征可引起明显的疼痛并影响患者的日常生活，因此，应重视手足综合征的防治，可采取的措施包括手足皮肤的保湿、减少承重、穿软底鞋、涂抹尿素霜和糖皮质激素类软膏，对严重的手足综合征，暂停药物治疗或减量可迅速缓解症状。

由于抗血管生成作用，索拉非尼和舒尼替尼均可引起高血压，并可能增加出血和心脑血管事件的风险，治疗前应谨慎评估患者发生这些不良反应的风险，治疗中应严密监测并积极预防。必须教育患者定期监测血压，如出现血压升高，首选ACEI/ABR类药，也可应用β受体阻滞药。

此类药物可以引起骨髓抑制，QT间期延长、有症状的心功能不全和甲状腺功能减低。因此治疗过程中严密监测心功能、血常规和甲状腺功能是至关重要的。

尚无在妊娠妇女应用小分子激酶抑制药的资料。哺乳期妇女如应用这些药物时应停止母乳喂养。

吉非替尼

Gefitinib

【适应证】既往接受过铂类和多西紫杉醇治疗或不适于化疗的晚期或转移性非小细胞肺癌。在优势人群（女性，腺癌、不吸烟及EGFR有基因突变等）也可用于一线治疗。

【注意事项】(1) 接受本品治疗的患者，偶尔可发生急性间质性肺病，部分患者可因此死亡。伴有先天性肺纤维化、间质性肺炎、肺尘病、放射性肺炎、药物诱发性肺炎的患者出现这种情况时死亡率增加。若患者气短，咳嗽和发热等呼吸道症状加重，应中断治疗，及时查明原因。当证实有间质性肺病时，应停药并进行相应治疗。(2) 应告诫患者有眼部症状、严重或持续的腹泻、恶心、呕吐或厌食加重时应立即就医。(3) 定期检查肝功能，转氨酶轻、中度升高者慎用，严重升高者停药。(4) 治疗期间可出现乏力症状，影响驾驶及操纵机器能力。(5) 不推荐用于儿童或青少年。

【禁忌证】对本品或赋形剂有严重过敏反应者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见腹泻、口腔黏膜炎、口腔溃疡、胰腺炎、脓疱性皮疹、指甲异常、多形性红斑、血管性水肿、荨麻疹、皮肤干燥、瘙痒、痤疮、肝功能异常、疲乏、脱发、体重下降、外周性水肿、结膜炎、眼睑炎、睫毛生长异常、弱视、角膜糜烂、角膜脱落、眼部缺血或出血、鼻出血、血尿、INR升高、出血性膀胱炎、胰腺炎、呼吸困难和间质性肺病。

【用法与用量】口服：一次250 mg，一日1次，空腹或与食物同服。

【制剂与规格】吉非替尼片：0.25 g。

厄洛替尼

Erlotinib

【适应证】两个或以上化疗方案失败

的局部晚期或转移的非小细胞肺癌。

【注意事项】同服华法林或其他双香豆素类抗凝药的患者应定期监测凝血酶原时间或 INR。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】可见腹泻、腹痛、食欲下降，疲乏、呼吸困难、咳嗽、恶心、呕吐、感染、口腔黏膜炎、皮疹、荨麻疹、皮肤干燥、结膜炎、干燥性角结膜炎、肝功能异常、ALT 及 AST 和胆红素升高。

【用法与用量】口服：一次 150 mg，一日 1 次，进食前 1 小时或进食后 2 小时服用。

【制剂与规格】盐酸厄洛替尼片：① 25 mg；② 100 mg；③ 150 mg。

索拉非尼

Sorafenib

【适应证】不能手术的晚期肾细胞癌及原发性肝癌。

【注意事项】(1) 注意治疗期间血压变化、出血风险、骨髓抑制。(2) 合用华法林的患者应定期进行相关检查。(3) 有活动性出血倾向的患者应慎用，且不宜进行肌内注射，因本品可能诱发血小板减少、使患者易出现出血、碰伤或血肿等情况。(4) 既往进行过骨髓抑制治疗（包括放疗和化疗）的患者慎用。(5) 活动性感染（包括真菌感染或病毒感染）患者在应用本品前宜先进行相关治疗，曾感染过带状疱疹、单纯疱疹等疱疹病毒或有其他病毒感染既往史的患者，化疗后感染可能复发。(6) 本品在儿童患者中的安全性和有效性尚未得到验证。(7) 肝病、黄疸或肾病患者慎用。

【禁忌证】对本品或非活性成分严重过敏者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 血液系统：可见淋巴细胞减少、白细胞及中性粒细胞减少、血小板减少、贫血、低磷血症、低钠血症、脱水。(2) 消化系统：可见腹泻、便秘、食欲减退、恶心、呕吐、吞咽困难、口腔炎、脂肪酶升高、淀粉酶升高、胰腺炎。(3) 中枢神经系统：可见发热、头痛、面部潮红、抑郁、疲乏、虚弱、耳鸣。(4) 生殖系统：可见阴茎勃起功能障碍、男性乳房发育。(5) 皮肤及软组织：可见皮疹、皮肤脱屑、瘙痒、红斑、皮肤干燥、脱发、手足综合征。(6) 其他：可见血压升高、肢体疼痛，关节炎、声嘶。

【用法与用量】口服：一次 0.4 g，一日 2 次，空腹或伴低脂、中脂饮食服用，治疗持续至患者不能临床受益或出现不可耐受的毒性反应。出现不良反应时，剂量可减为 0.4 g，一日或隔日 1 次，必要时停药。

【制剂与规格】甲苯磺酸索拉非尼片：0.2 g。

舒尼替尼

Sunitinib

【适应证】伊马替尼治疗失败或不能耐受的胃肠道间质瘤（GIST），不能手术的晚期肾细胞癌（RCC）。

【注意事项】(1) 若出现充血性心力衰竭的临床表现应停药。无充血性心力衰竭临床证据但射血分数 < 50% 以及射血分数低于基线 20% 的患者也应停药或减量。(2) 本品可延长心电图 QT 间期，且呈剂量依赖性，应慎用于已知有心电图 QT 间期延长病史、服用抗心律失常药物或有相应基础心脏疾病、心动过缓和电解质紊乱的患者。(3) 用药期间如果发生严重高血压，应暂停使用，直至高血压得到控制。(4) 育龄妇女用药时应避孕；哺乳期妇女用药时应停止哺乳。

【禁忌证】对本品或非活性成分严重过敏者。

【不良反应】(1) 消化系统：可见食欲减退、厌食、消化不良、恶心、呕吐、腹泻、腹痛、便秘、味觉改变、黏膜炎、口腔炎、ALT 及 AST 升高、脂肪酶、碱性磷酸酶、淀粉酶、总胆红素、间接胆红素、肌酐升高。(2) 循环系统：可见左心室功能障碍、左室射血分数下降、心电图 QT 间期延长、静脉血栓事件、高血压、外周性水肿、可逆性后脑白质脑病综合征。(3) 中枢神经系统：可见发热、头晕、头痛、背痛、关节痛、四肢痛、疲乏、体重改变、灵敏性下降、神精功能改变、视力丧失、结膜炎、嗜睡。(4) 呼吸系统：可见呼吸困难。(5) 血液系统：可见出血、低

血钾，高血钠、血小板减少、白细胞减少、淋巴细胞减少及甲状腺功能减退。(6) 皮肤及软组织：可见皮疹、手足综合征、皮肤变色。

【用法与用量】口服：一次 50 mg，一日 1 次，服药 4 周，停药 2 周（4/2 给药方案）。与食物同服或不同服均可。

【制剂与规格】苹果酸舒尼替尼胶囊：① 12.5 mg；② 25 mg；③ 50 mg。

伊马替尼

Imatinib

【适应证】用于慢性髓性白血病急变期、加速期或干扰素 α 治疗失败后的慢性期患者，不能切除和（或）发生转移的恶性胃肠道间质肿瘤（GIST）的成人患者。

【注意事项】(1) 儿童患者水潴留可能不出现可以识别的水肿、水潴留可以加重或导致心力衰竭，严重心力衰竭者、青光眼的患者应慎用。(2) 可能出现胃肠道出血和肿瘤内出血，在治疗初始应监测患者的胃肠道症状。(3) 有肝功损害者慎用。(4) 定期检查血象、肝功能。

【禁忌证】对本品活性物质或任何赋形剂过敏者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】常见有疲乏、全身水肿、恶心、呕吐、腹泻、消化不良、腹痛、腹胀、胀气、便秘、口干、尿潴留、发热、疲劳、畏寒、体重增加、中性粒细胞计数减少、血小板减少、贫血、发热性中性粒细胞减少、全血细胞减少、食欲减退、头痛、头晕、味觉障碍、感觉异常、失眠、结膜炎、流泪增多、胸腔积液、鼻出血、皮炎、湿疹、皮疹、眼睑肿胀、眶周肿、瘙痒、红皮症、皮肤干燥、脱发、盗汗、肌痉挛、疼痛性肌痉挛、骨骼肌痛包括关节肿胀；偶见有脱水、高尿酸血症、低钾血症、低钠血症、食欲增加、晕厥、偏头痛、周围神经病变、出血性卒中、嗜睡、眼刺激症状、视物模糊、结膜出血、眼干、眶周水肿、肺水肿、心动过速、心力衰竭、血肿、高血压；罕见乳房肿大、男性乳房女性化、坐骨神经痛、肌酐升高、肾衰竭、引导阴囊水肿、紫癜、指甲断裂、多汗、高胆红质症、荨麻疹、光敏反应。

【用法与用量】口服。成人一日 1 次，儿童和青少年一日 1 次或分 2 次服用，宜在进餐时服用，并饮一大杯水，不能吞咽胶囊的患者（儿童），可将胶囊内药物分散于水或苹果汁中。CML 患者慢性期，一日 400 mg；急变期和加速期，一日 600 mg，只要有效，就应持续服用。不能切除和（或）转移的恶性 GIST，一日 400 mg，治疗后如未获得满意效果，若无药品不良反应，可考虑增加剂量至一日 600 mg。治疗剂量应依据出现的不良反应做调整。

【制剂与规格】甲磺酸伊马替尼胶囊：100 mg。

10.3.5 其他药物及辅助用药

重组人血管内皮抑制素

Recombinant Human Endostatin

【适应证】联合 NP 化疗方案治疗初治或复治的Ⅲ / Ⅳ期非小细胞肺癌。

【注意事项】(1) 过敏体质或对蛋白类生物制品有过敏史者慎用。(2) 有严重心脏病或病史者以及顽固性高血压者慎用，治疗中应定期进行心电监测，出现心脏不良反应者应进行心电监护。(3) 儿童、妊娠及哺乳期妇女应在医师观察下用药。

【禁忌证】心、肾功能不全者慎用。

【不良反应】可见轻度疲乏、胸闷、心悸、心肌缺血、窦性心动过速、轻度 ST-T 段改变、房室传导阻滞、房性期前收缩；偶见室性期前收缩、腹泻、肝功能异常、ALT 及 AST 升高、黄疸、全身斑丘疹、瘙痒、发热及疲乏。

【用法与用量】静脉滴注，一次 7.5 mg/m^2（1.2×10^5 U/m^2），一日 1 次，用前加入 500 ml 氯化钠注射液，匀速滴注 3 ～ 4 小时，连续 14 日，休息 7 日，21 日为 1 个周期。通常可治疗 2 ～ 4 个周期。

【制剂与规格】重组人血管内皮抑制素注射液：3 ml : 15 mg。

亚砷酸 用于急性早幼粒细胞性白血病。静脉滴注，一次 10 mg 或一次 7 mg/m^2，加入氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 500 ml 中，滴注 3 ～ 4 小时，一日 1 次，

4周为1个疗程，间歇1～2周，可连续用药。

美司钠[保(乙)]

Mesna

【适应证】用于预防氧氮磷环类（环磷酰胺、异环磷酰胺）引起的泌尿道毒性，应用大剂量环磷酰胺（> 10 mg/kg）和异环磷酰胺时，曾做骨盆放射、曾用上述3种药物治疗而发生膀胱炎及有泌尿道损伤病史者。

【注意事项】(1) 自身免疫功能紊乱的患者使用本品发生过敏反应的病例较肿瘤患者为多，应预先评估后在医护人员的监督下使用。(2) 本品的保护作用只限于泌尿系统的损害。当使用本品治疗时可引起尿酮试验假阳性反应。(3) 妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品或其他含巯醇化合物过敏者。

【不良反应】可见皮肤与黏膜的过敏反应、低血压、心率加快、短暂ALT及AST升高、发热、恶心、呕吐、痉挛性腹痛、腹泻、疼痛、肢体痛、血压降低、心动过速、皮肤反应、抑郁、疲倦、虚弱、注射部位静脉刺激。

【用法与用量】静脉注射：常用剂量为异环磷酰胺和环磷酰胺的20%，时间为0时段、4小时后及8小时后的时段。

【制剂与规格】美司钠注射液：①2 ml：200 mg；② 4 ml：400 mg。

右雷佐生（右丙亚胺）[保(乙)]

Dexrazoxane

【适应证】本品可减少多柔比星引起的心脏毒性的发生率和严重程度，用于减轻蒽醌类抗生素化疗引起的心脏毒性，对接受多柔比星治疗累积量达300 mg/m²，且医生认为继续使用多柔比星有利的女性转移性乳腺癌患者。对刚开始应用多柔比星者不推荐用此药。

【注意事项】(1) 不可用于没有联用蒽环类药的化学治疗，本品可增加化疗药物所引起的骨髓抑制。(2) 尽管本品对心脏有保护作用，但不能消除心脏中毒的风险，对多柔比星累计剂量达300 mg/m²患者，即使使用本品，也应密切监测心脏毒性。(3) 同时使用其他骨髓抑制药的患者应慎用。(4) 孕妇使用应权衡利弊，只有在本品对胎儿的影响小于其益处时方可应用。是否由人乳汁排出尚不清楚，用本品治疗期间的妇女应停止哺乳。(5) 用药前后及用药时应监测血常规、肝功能及血清铁、锌浓度。(6) 配成后的稀释溶液，在室温15～30℃或冷处2～8℃，仅能保存6小时。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 与化疗药物联用时严重者可致骨髓抑制，常见白细胞、血小板计数减少，凝血障碍和贫血。(2) 可能引起高三酰甘油血症，增高血清铁浓度，降低血清锌和钙的浓度，同时促进铁、锌、钙经尿液排泄。(3) 可有恶心、呕吐、腹泻、AST及ALT升高，也有血清淀粉酶升高的报道。(4) 注射局部可发生炎症，亦有皮肤及皮下坏死和脂膜炎的报道。

【用法与用量】静脉滴注：推荐剂量为多柔比星剂量的10倍，比例为10∶1（右雷佐生500 mg/m²：多柔比星50 mg/m²）。本品需用0.167 mol/L乳酸钠注射液25 ml溶解，稀释至10 mg/ml，然后用氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液将本品再稀释成1.3～5.0 mg/ml浓度，转移入输液袋，快速静脉滴注，30分钟后方可给予多柔比星。

【制剂与规格】注射用右雷佐生：250 mg。

溴米因注射液[保(乙)]：本品每2 ml含溴米那2 mg，盐酸普鲁卡因3 mg和苯酚6 mg。用于妊娠呕吐、神经性呕吐、晕动症、呃逆等引起的呕吐。肌内注射，一次2 ml。对顽固性呕吐可适当增加剂量和注射次数。

昂丹司琼[保(乙)]

Ondansetron

【适应证】用于治疗和预防癌症患者接受细胞毒性药物化疗和放疗引起的恶心、呕吐。

【注意事项】(1) 本品注射剂不能与其他药物混于同一注射器中使用或同时输入。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者、胃肠道梗阻者。

【不良反应】常见头痛、头部和上腹部温热感；偶见便秘、短暂性 ALT 及 AST 升高；罕见过敏反应。

【用量与用法】(1) 用于顺铂等高度催吐化疗药物的止吐：第 1 日于化疗前，15 分钟内缓慢静脉注射或静脉滴注 8 mg，接着 24 小时内，静脉滴注每小时 1 mg。第 2 ~ 6 日，餐前 1 小时口服本品，每 8 小时服 8 mg。(2) 用于催吐程度不太强烈的化疗药：如环磷酰胺、多柔比星、卡铂的止吐，化疗前，15 分钟内静脉输注本品 8 mg，或是化疗前 1 ~ 2 小时，口服本品 8 mg，接着每 8 小时口服 8 mg，连服 5 日。(3) 用于放射治疗的止吐：放疗前 1 ~ 2 小时口服 8 mg，以后每 8 小时服 8 mg，疗程视放疗的疗程而定。(4) 4 岁以上儿童，化疗前 15 min 内静脉输注 5 mg/m^2，接着每 8 小时服 4 mg，连用 5 日。

【制剂与规格】昂丹司琼片：① 4 mg；② 8 mg。

盐酸昂丹司琼注射液：① 2 ml : 4 mg；② 4 ml : 8 mg。

格拉司琼 [保(乙)]

Granisetron

【适应证】用于防治化疗和放疗引起的恶心与呕吐。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用，哺乳期间妇女应用本品应停止哺乳。(2)儿童用药的效果与安全性未确定。(3)本品可减慢结肠蠕动，若有亚急性肠梗阻时应慎用。(4) 本品不应与其他药物混合使用。

【禁忌证】小儿、对本品过敏者、胃肠道梗阻者。

【不良反应】常见头痛、便秘、嗜睡、腹泻、ALT 及 AST 升高，有时可有血压暂时性变化，停药后即可消失。

【用量与用法】静脉注射：推荐剂量一次 3 mg，在化疗前 5 分钟注入，如症状出现，24 小时内可增补 3 mg。本品 3 mg 通常用 20 ~ 50 ml 等渗氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液稀释，在 5 ~ 30 分钟注完。1 个疗程可连续用 5 日。

【制剂与规格】盐酸格拉司琼注射液：① 1 ml : 1 mg；② 3 ml : 3 mg。

托烷司琼 [保(乙)]

Tropisetron

【适应证】用于防治化疗和放疗引起的恶心与呕吐。

【注意事项】哺乳期妇女不宜使用，心脏病患者、未控制的高血压患者、开车或操纵机器时慎用。

【禁忌证】对本品过敏者及孕妇禁用。

【不良反应】常见头痛、便秘、头晕、疲劳、肠胃功能紊乱（腹痛、腹泻）、过敏反应等。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注。一日 5 mg，疗程 6 日。于化疗前将本品 5 mg 溶于 100 ml 氯化钠、复方氯化钠液或 5% 葡萄糖注射液中静滴或缓慢静推。口服可于静脉给药的第 2 ~ 6 日，一次 5 mg，一日 1 次，于早餐前至少 1 小时服用。

【制剂与规格】盐酸托烷司琼胶囊：5 mg。

盐酸托烷司琼注射液：5 ml : 5 mg。

替莫唑胺 [保(乙)]

Temozolomide

【适应证】用于新诊断的多形性胶质母细胞瘤，开始先与放疗联合治疗，随后作为辅助治疗；常规治疗后复发或进展的多形性胶质母细胞瘤或间变性星形细胞瘤。

【注意事项】(1) 应用本品有可能出现骨髓抑制，给药前患者必须进行绝对中性粒细胞及血小板计数检查。在治疗第 22 日（首次给药后的 21 日）或其后 48 小时内检测患者的全血计数，之后每周测定 1 次，直到测得的绝对中性粒细胞计数 (ANC) ≥ 1.5 × 10^9/L，血小板计数 ≥ 100 × 10^9/L 时，再可进行下一周期的治疗。(2) 肝、肾功能不全者慎用。(3) 本品可影响睾丸功能，男性患者应采取避孕措施。女性患者在接受治疗时应避免妊娠，哺乳期妇女应停止哺乳。(4) 本品适宜空腹服用（进餐前至少 1 小时），应用 1 杯水整粒吞服。胶囊剂如有破损时，应避免胶囊内粉状内容物与皮肤或消化道黏膜接

触。(5) 在长期的给药方案治疗期间，接受替莫唑胺治疗者卡氏肺囊虫性肺炎发生率可能较高。不管何种治疗方案，均应密切观察本品治疗的全部患者（特别是接受糖皮质激素治疗者）发生卡氏肺囊虫性肺炎的可能性。(6) 对新诊断多形性胶质母细胞瘤的患者，在开始接受本品合并治疗前，建议采用止吐药预防呕吐；在辅助治疗期间，建议采用止吐药预防。对神经胶质瘤复发或进展的患者，在以前治疗周期中曾出现过重度（3级或4级）呕吐的患者需要应用止吐药治疗。

【禁忌证】对本品及辅料过敏者禁用。由于本品与达卡巴嗪均代谢为MTIC，对达卡巴嗪过敏者禁用。妊娠期或即将妊娠的妇女禁用。严重骨髓抑制的患者禁用。

【不良反应】十分常见恶心、呕吐、便秘、腹泻、食欲减退、味觉异常、疲惫、头痛、呼吸短促、脱发、贫血、瘙痒、皮疹、发热、免疫力下降、贫血、全血细胞、白细胞和血小板计数减少等，可能会出现骨髓抑制，但可恢复，患者应定期地检测血常规；常见腹痛、疼痛、头晕、体重下降、全身不适、呼吸困难、僵直、消化不良、感觉异常和瘀点；少见机会性感染包括卡氏肺囊虫性肺炎；极少见多形性红斑、中毒性表皮坏死、Stevens-Johnson 综合征和变态反应（包括过敏反应）病例。

【用法与用量】口服：用于新诊断的多形性胶质母细胞瘤的成人患者，同步放化疗期口服本品，一日剂量为 75 mg/m^2，共 42 日，同时接受放疗（60 Gy 分 30 次）；随后接受 6 个周期的本品辅助治疗。根据患者耐受程度可暂停用药，但无需降低剂量。同步放化疗期如符合以下条件：绝对白细胞计数≥1.5×10^9/L，血小板计数≥100×10^9/L，普通毒性标准（CTC）- 非血液学毒性≤1级（除外脱发、恶心和呕吐），可连续使用 42 日，直至 49 日。在同步化疗期间应按血液学和非血液学毒性标准暂停或终止服用。放疗合并期间暂停或终止服用：①如出现以下情况应暂停服用：绝对白细胞计数≥0.5×10^9/L 和 <1.5×10^9/L；血小板计数≥10×10^9/L 和 <100×10^9/L；CTC 非血液学毒性（脱发、恶心和呕吐除外）2级。②如出现以下情况应终止服用：绝对白细胞计数 <0.5×10^9/L；血小板计数 <10×10^9/L；CTC- 非血液学毒性（脱发、恶心和呕吐除外）3级或4级。③如符合以下标准，可继续用本品同时治疗：绝对白细胞计数≥1.5×10^9/L，血小板计数≥100×10^9/L，CTC- 非血液学毒性≤1级（脱发、恶心和呕吐除外）。辅助治疗期：本品同步放化疗期结束后 4 周，进行 6 个周期的本品辅助治疗。第 1 周期的本品剂量是一日 150 mg/m^2，一日 1 次，共 5 日，然后停药 23 日。第 2 周期开始时，如果第 1 周期 CTC 非血液学毒性≤2级（除外脱发、恶心和呕吐）、绝对白细胞计数（ANC）≥1.5×10^9/L 和血小板计数≥100×10^9/L，则剂量可增至一日 200 mg/m^2。如果第 2 周期的剂量没有增加，在以后的周期中也不应增加剂量。除出现毒性外，以后各周期的剂量维持在每日 200 mg/m^2。辅助治疗期间应按下述降低剂量。治疗期间，第 22 日（首剂本品后 21 日）应进行全血细胞的计数。辅助治疗的剂量水平：剂量水平：−1（剂量为一日 100 mg/m^2），因较早的毒性而减量。剂量水平：0（剂量为一日 150 mg/m^2），第 1 周期的剂量。剂量水平：1（剂量为一日 200 mg/m^2），第 2～6 周期无毒性时的剂量。辅助治疗期间减量或终止用药：如出现以下情况，本品剂量（如前述剂量水平）降低 1 个水平：绝对白细胞计数 <1.0×10^9，血小板计数 <50×10^9/L；CTC 非血液学毒性（脱发、恶心和呕吐除外）3级。如出现以下情况应终止服用本品：绝对白细胞计数 <1.0×10^9/L 或血小板计数 <50×10^9/L：如果需要将本品剂量降至 <100 mg/m^2，或如降低剂量后重新出现同样的 CTC 非血液学毒性 3 级（脱发、恶心和呕吐除外）；或 CTC 非血液学毒性（脱发、恶心和呕吐除外）4 级，则应终止本品治疗。常规治疗后复发或进展的多形性胶质母细胞瘤或间变性星形细胞瘤患者，成人患者：以前曾接受过化疗患者的起始剂量一日 150 mg/m^2，共 5 日。如下个周期第 1 日的 ANC≥1.5×10^9/L 和血小板计数≥100×10^9/L，则第 2 周期的剂量增为一日 200 mg/m^2。

应根据ANC和血小板计数最低值调整剂量。儿童患者：在以前曾接受过化疗3岁或3岁以上的患儿中，每28日周期中本品口服起始剂量是一日150 mg/m^2，共5日；如没有出现毒性，下个周期的剂量增至一日200 mg/m^2。治疗可继续到病变出现进展，最多为2年。

【制剂与规格】替莫唑胺片：① 5 mg；② 20 mg；③ 50 mg。

第11章 肠外肠内营养与调节水、电解质、酸碱平衡药

本章包括临床营养（肠外营养和肠内营养）用药及水、电解质、酸碱平衡用药、维生素和矿物质用药3大类。

肠外、肠内营养支持是指通过消化道外或内的各种途径为患者提供较为全面的机体所需的各种营养物质，以期达到预防或纠正营养不良（指营养不足）、增强患者对感染创伤等应激的耐受力、减少并发症、减少费用、改善患者的临床结局的目的，从而使患者受益。根据其输注途径，分为肠外营养（parenteral nutrition，PN）和肠内营养（enteral nutrition，EN）。

是否需要给患者肠外、肠内营养支持，是临床的具体问题。目前中华医学会肠外肠内营养学分会推荐用营养风险筛查和结合临床来考虑是否有适应证。营养风险的定义是“现存的或潜在的与营养相关的因素导致患者出现不良临床结局的风险”，是以临床结局为终点，不是以出现营养不良为终点。当评分≥3分时，患者有营养风险。该筛查的评分来源有3个方面：一是疾病严重程度（包括将要进行的手术）评分；二是营养状况受损评分；三是年龄评分，如70岁以上的患者对饥饿的耐受性差，更需要营养支持。

当有营养风险时（评分≥3分）结合临床，需要为患者制定营养支持计划。具体操作方法见“中华医学会肠外肠内营养学分会”2006版和2008版的临床诊疗指南及2007版规范。

肥胖患者在患病时如有需要应用肠外、肠内营养支持，目前的基本方法是：给予低热量供给（每日20 kcal/kg或更低）和正常量的蛋白（氨基酸）摄人。

但并非所有存在营养风险的患者均需接受营养支持，应结合临床进行具体分析，下列情况一般不给肠外或肠内营养支持：①不可治愈、无存活希望的终末期患者，考虑用水、电解质维持。②急诊手术患者。③低BMI值的特殊个体。④心血管功能或严重代谢紊乱需要控制者。⑤无营养风险患者。

11.1 肠外营养药

肠外营养（parenteral nutrition，PN）是经静脉途径为经胃肠道摄取和利用营养物质不能或不足的患者提供包括氨基酸、脂肪、糖类、维生素及矿物质在内的营养素，为患者的康复或生长需求提供必要的基质。

肠外营养既可作为肠内营养不足的补充，也可以作为患者唯一的营养来源。是否需要肠外营养支持，可以借助营养筛查工具，结合临床，以了解是否具有营养支

持适应证。

凡有营养支持适应证的患者，如接受肠内营养不能或不足，都是肠外营养的适应证，如短肠综合征、肠外瘘等，详见分会指南和规范。

肠外营养一般应通过专门的静脉途径给予“全合一”营养液，外周静脉是首选的输注途径，如果营养液渗透压较高，或时间超过2周，推荐通过中心静脉途径[包括经外周中心静脉置管（PICC）]输注肠外营养液。

肠外营养期间应定期评定脏器功能、血脂和电解质状况。长期肠外营养的并发症包括胆汁淤积、胆囊炎、胆结石和肝功能异常等。要了解肠外营养并发症的预防和处理，建议参考分会的指南和规范。

11.1.1 脂肪乳

以往认为脂肪乳剂有两个基本功能：为机体提供能量（每克脂肪提供9 kcal热能）和必需脂肪酸。

除此两个基本功能外，最近10年出现的ω-3鱼油脂肪乳剂可用来调节ω-3和ω-6脂肪酸的比例，是一种新型的脂肪乳剂。临床研究显示，合理的ω-3和ω-6的比例（1∶3左右）有改善患者免疫功能和改善结局的作用。

临床上目前将脂肪乳剂分为长链和中长链两大类。

11.1.1.1 长链脂肪乳

长链脂肪乳剂，包括：脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$），是以静脉注射标准的大豆油为基础的脂肪乳剂；ω-3鱼油脂肪乳注射液，是以精炼鱼油为基础的脂肪乳剂；长链脂肪乳注射液（OO），是指橄榄油和大豆油按比例混合的脂肪乳剂。

脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）[保（乙）]

Fat Emulsion Injection ($C_{14\sim24}$)

【适应证】用于肠外营养补充能量及必需脂肪酸。

【注意事项】(1) 本品慎用于脂肪代谢功能减退的患者。(2) 应密切观察血清三酰甘油浓度。(3) 新生儿和未成熟儿伴高胆红素血症（血浆胆红素达到170μmol/L）或可疑肺动脉高压者应慎用本品，新生儿和未成熟儿长期使用本品须监测血小板数目、肝功能和血清三酰甘油。(4) 采血时，如本品还未从血流中完全清除，将干扰其他实验室检测项目（如胆红素、乳酸脱氢酶、血氧饱和度、血红蛋白等），也说明须做廓清检查。(5) 连续使用本品1周以上者，或在临床上有需要时，应做脂肪廓清观察。简易观察方法是：空腹静脉取血，离心后观察血清，如果呈乳糜色或不透明，则原定的输注计划应取消或延期实施；明显高脂血症不适宜应用脂肪乳注射液；当患者脂肪廓清能力有可能降低时，应再查血清三酰甘油。(6) 脂肪乳输注期间，血脂以不从原来水平有明显增加为佳。(7) 本品开瓶后一次未使用完的药液应予丢弃，不得再次使用。

【禁忌证】(1) 休克和严重脂质代谢紊乱（如严重高脂血症）患者。(2) 肠外营养的一般禁忌证：低钾血症、水钠潴留、低渗性脱水、不稳定代谢、酸中毒等。(3) 失代偿性糖尿病、急性心肌梗死、脑卒中、栓塞、不明原因昏迷的患者。(4) 重度肝功能障碍和凝血功能障碍的患者。(5) 伴有酮症的糖尿病患者。(6) 对本品中各成分（如大豆油、卵磷脂等）有过敏反应的患者。

【不良反应】输入速度过快可引起体温升高，偶见发冷、恶心和呕吐等。其他不良反应较罕见，包括：(1) 即刻和早期不良反应：高过敏反应（变态反应、皮疹、荨麻疹），呼吸影响（如呼吸急促等）及循环影响（如高血压／低血压等）。溶血、网织红细胞增多、腹痛、头痛、疲倦、阴茎异常勃起等。(2) 迟发不良反应：长期输注本品，婴儿可能发生血小板减少。偶见静脉炎、血管痛及出血倾向。(3) 患者脂肪廓清能力减退时，尽管输注速度正常仍可致脂肪超载综合征。

【用法与用量】本品常用于配制含葡萄糖、脂肪、氨基酸、电解质、维生素和微量元素等的“全合一”营养混合液。本品也可与葡萄糖氨基酸混合注射液通过Y形管混合后输入体内，适用于中心静脉和外周静脉。(1) 静脉滴注：成人按脂肪量计，剂量在一日2 g三酰甘油／kg内为宜。

（2）10% 和 20% 脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）500 ml 的输注时间分别不少于 5 小时和 10 小时；30% 脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）250 ml 的输注时间不少于 8 小时。（3）新生儿和婴儿，脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）使用剂量为一日 0.5 ~ 3 g 三酰甘油 /kg，静脉滴注速度不超过每小时 0.17 g/kg。对早产儿及低体重新生儿，应 24 小时连续输注，开始剂量为一日 0.5 ~ 1 g/kg，以后逐渐增加至一日 2 g/kg。应征求儿科医师的意见。

【制剂与规格】脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）：① 10% 100 ml；② 10% 250 ml；③ 10% 500 ml；④ 20% 100 ml；⑤ 20% 250 ml；⑥ 20% 500 ml；⑦ 30% 100 ml；⑧ 30% 250 ml。

ω-3 鱼油脂肪乳注射液 [保（乙）]

ω-3 Fish Oil Fat Emulsion Injection

【适应证】用于肠外营养支持时，补充长链 ω-3 脂肪酸。常用于调整患者 ω-3 脂肪酸和 ω-6 脂肪酸的比例到 1 : 3 左右。有调节患者免疫功能的作用。

【注意事项】（1）孕妇及哺乳期妇女不推荐使用。（2）使用本品有可能延长出血时间，抑制血小板聚集，因此接受抗凝治疗的患者应慎用本品。（3）临床应用本品应在 4 周以内，当医疗需要超过 4 周时间，应由主治医师结合临床情况进行分析和评估后继续使用。（4）其余见脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）。

【禁忌证】对鱼蛋白过敏、肝肾功能异常、早产儿、新生儿、婴幼儿、儿童忌用。

【不良反应】本品有可能造成患者出血时间延长及抑制血小板聚集。极少数患者可能感觉鱼腥味，阴茎异常勃起（极罕见）。余同脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）。

【用法与用量】本品应与其他脂肪乳同时使用。一日剂量：一日输注本品 1 ~ 2 ml/kg，相当于鱼油 0.1 ~ 0.2 g/kg。最大滴注速度：1 小时的滴注速度不可超过 0.5 ml/kg，相当于不超过鱼油 0.05 g/kg。本品临床应用不应超过 4 周，延长应用时间时，需由医师根据临床需要来定。

【制剂与规格】ω-3 鱼油脂肪乳注射液：① 50 ml : 5 g（精制鱼油）与 0.6 g（卵磷脂）；② 100 ml : 10 g（精制鱼油）与 1.2 g（卵磷脂）。

长链脂肪乳注射液（OO）

Long Chain Fat Emulsion Injection（OO）

【适应证】适用于进行肠外营养补充脂肪。本品为橄榄油及大豆油混合物。橄榄油的单不饱和脂肪酸（MUFA）含量较高，但没有短期输入后改善临床结局的随机对照临床研究报告。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】【用法与用量】同脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）。

【制剂与规格】长链脂肪乳注射液（OO）20%：① 100 ml : 20 g（脂肪）与 1.2 g（卵磷脂）；② 250 ml : 50 g（脂肪）与 3 g（卵磷脂）；③ 1 000 ml : 200 g（脂肪）与 12 g（卵磷脂）。

11.1.1.2 中长链脂肪乳

中链及长链脂肪乳剂，包括：中 / 长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$），是指物理混合的中链和长链脂肪乳剂；中 / 长链脂肪乳注射液（$C_{8\sim24}Ve$），是指添加维生素 E 的物理混合的中链和长链脂肪乳剂；结构脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$），是指分子结构中混含中链和长链脂肪酸的乳剂。

中 / 长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）[保（乙）]

Medium and Long Chain Fat Emulsion Injection($C_{6\sim24}$)($C_{8\sim24}$)

【适应证】基本同脂肪乳注射液。适用于肝功能轻度受损和创伤后患者。

【注意事项】【禁忌证】【用法与用量】同脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）。

【不良反应】中链三酰甘油的分子量较小，可通过血脑屏障，动物实验中大剂量快速滴注时可能产生神经毒性反应，但仅限于动物实验。中 / 长链脂肪乳注射液在临床应用中无神经毒性反应报告。在正常输注中链三酰甘油的过程中，有轻微的不超过正常水平的升高酮体作用，不超过正常水平的升高酮体作用可通过胰岛素机制改善蛋白质代谢。但是，如果患者已经有酮症酸中毒时，不宜应用。余同脂肪乳

注射液（$C_{14\sim24}$）。

【制剂与规格】中／长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）：① 10% 250ml：大豆油 11.5g 与中链三酰甘油 11.5g 与卵磷脂 1.5g；② 10% 500ml：大豆油 25g 与中链三酰甘油 25g 与卵磷脂 3g；③ 20% 250ml：大豆油 25g 与中链三酰甘油 25g 与卵磷脂 3g；④ 20% 500ml：大豆油 50g 与中链三酰甘油 50g 与卵磷脂 6g。

中／长链脂肪乳注射液（$C_{8\sim24}V_E$）[保（乙）]

Medium and Long Chain Fat Emulsion Injection ($C_{8\sim24}V_E$)

【适应证】本品加入维生素 E，有抗注射液中甘油三酸酯被氧化的作用。余同中／长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同中／长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）。

【用法与用量】静脉滴注，按脂肪量计算，剂量一日 1 ～ 2g 三酰甘油 /kg，滴注速度每小时 0.125g 三酰甘油 /kg。余参见中／长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）。

【制剂与规格】中／长链脂肪乳注射液（$C_{8\sim24}V_E$）：① 10%，500 ml；② 20%，100 ml；③ 20%，250 ml。

结构脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）

Structural Fat Emulsion Injection ($C_{6\sim24}$)

结构三酰甘油是将等摩尔数的长链三酰甘油和中链三酰甘油混合后，在一定的条件下，进行水解和酯化反应后形成的混合物。其中约 75% 为混合链三酰甘油，即所结合的三分子脂肪酸，既有长链脂肪酸，又有中链脂肪酸，呈随机分布。其余部分为长链三酰甘油和中链三酰甘油。

【适应证】【禁忌证】【不良反应】同中／长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）。

【用法与用量】静脉滴注。1 ～ 1.5g 三酰甘油 /kg，每小时 0.15g 三酰甘油 /kg，余见中／长链脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）（$C_{8\sim24}$）。

【制剂与规格】结构脂肪乳注射液（$C_{6\sim24}$）：① 20%，250 ml：结构三酰甘油 50g；② 20%，500 ml：结构三酰甘油 100g。

11.1.2 氨基酸

氨基酸是合成蛋白质和其他生物活性物质的底物。其中有 8 种必需氨基酸不能自身合成，必须体外补充；有些在疾病时自身合成不足，须额外供给，为条件必需氨基酸。肠外肠内营养学分会指南建议健康成人氨基酸基本需要量是一日 0.8 ～ 1.0g/kg，在严重分解代谢、明显的蛋白质丢失或重度营养不良时需要适当增加一些补充量。如无特殊代谢情况的限制，可选用所含氨基酸种类完整的平衡型氨基酸溶液。对于需要肠外营养支持的重症患者，推荐在肠外营养配方中添加谷氨酰胺双肽。

已上市的复方氨基酸注射液在临床上应用广泛。其主要组分是必需氨基酸（平衡型氨基酸注射液的必需氨基酸量一般需 > 40%），也含有非必需氨基酸。按含氨基酸种类分有 3 种、6 种、9 种、14 种、15 种、17 种、18 种、20 种等；按含总氨基酸的浓度可分为 3% ～ 12% 不等。

11.1.2.1 常用氨基酸

复方氨基酸（18AA）[基（基），保（甲）]

Compound Amino Acid (18AA)

【适应证】(1) 不能进食、进食不足或不愿进食。(2) 有营养风险患者及有营养不良（指营养不足）患者。(3) 肝肾功能基本正常的低蛋白血症者。(4) 大面积烧伤者。(5) 改善外科手术前、后患者的营养状态。

【注意事项】(1) 本品须缓慢输入。(2) 包装破损或药液变色浑浊等不能使用。(3) 用药时一次用完，剩余药液切勿再用。(4) 本制剂中含有抗氧化剂，偶可引起过敏反应。(5) 本品对孕妇安全性的评价尚不明确，必须权衡利弊后，方可决定是否应用。哺乳期妇女应避免使用。(6) 对于高龄患者，由于生理功能减退，应用本品应减小剂量，或减慢给药速度。

【禁忌证】严重氮质血症、严重肝功能不全、肝性脑病或有向肝性脑病发展、严重肾衰竭或尿毒症、对氨基酸有代谢障碍等的患者、对本品过敏者。

【不良反应】(1)滴速过快可引起恶心、呕吐、发热及头痛，也可能导致血栓性静脉炎。(2)长期大量输注可导致胆汁淤积、黄疸。(3)偶尔引起发疹样过敏反应、肝功能损害等，此时应中止给药。

【用法与用量】均需缓慢静脉滴注。根据年龄、病情、症状、体重等决定用量。一般一日输入0.1～0.2 g氮/kg较适宜，非蛋白热量氮之比为（120～150）：1，应同时给予足够的能量、适量的电解质、维生素及微量元素。

【制剂与规格】复方氨基酸（18AA）注射液：① 250 ml：11.5 g（总氨基酸）；② 500 ml：25 g（总氨基酸）；③ 250 ml：30 g（总氨基酸）。

复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）

Compound Amino Acid Injection (18AA-Ⅰ)

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】根据病情，缓慢滴注。老人及重症患者更需缓慢。在配伍合理性得到保证的前提下，可与葡萄糖注射液、脂肪乳注射液及其他营养要素按照适当的比例混合后经中心或周围静脉连续滴注，并根据年龄、症状、体重等情况决定用量。本品用于新生儿和婴儿患者时，应在开始使用1周内逐渐增加剂量，最大剂量为一日30 ml/kg。余同复方氨基酸注射液（18AA）。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液(18AA-Ⅰ)：① 250 ml：17.5 g(总氨基酸)；② 500 ml：35 g（总氨基酸）。

复方氨基酸注射液（18AA-Ⅱ）

Compound Amino Acid Injection (18AA-Ⅱ)

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】【用法与用量】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液(18AA-Ⅱ)：① 250 ml：11.5 g（总氨基酸）；② 500 ml：25 g（总氨基酸）；③250 ml：21.25 g（总氨基酸）；④500 ml：42.5 g（总氨基酸）；⑤ 250 ml：28.5 g（总氨基酸）；⑥ 500 ml：57 g（总氨基酸）。

复方氨基酸注射液（18AA-Ⅲ）

Compound Amino Acid Injection (18AA-Ⅲ)

【适应证】【禁忌证】【不良反应】【用法与用量】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【注意事项】本品含60 mEq／L的醋酸根，大量应用或并用电解质输液时应注意电解质与酸碱平衡。同复方氨基酸注射液（18AA）。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液(18AA-Ⅲ)：250 ml：25.90 g(总氨基酸)。

复方氨基酸注射液（18AA-Ⅴ）

Compound Amino Acid Injection (18AA-Ⅴ)

【适应证】【禁忌证】【不良反应】【用法与用量】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【注意事项】本品含盐酸盐，大量输入可能导致酸碱失衡。

【制剂与规格】同复方氨基酸注射液（18AA）。

复方氨基酸注射液（18AA-Ⅶ）[保(乙)]

Compound Amino Acids Injection (18AA-Ⅶ)

【适应证】【禁忌证】【不良反应】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【注意事项】本品含有80 mEq/L醋酸根，大量给药或与电解质液并用时应注意酸碱平衡。同复方氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】(1) 周围静脉给药：成人一次200～400 ml，缓慢静脉滴注，用量可根据年龄、症状、体重适当增减。本品最好与糖类同时输注。(2) 中心静脉给药：成人一日400～800 ml。可与糖类等混合，由中心静脉24小时持续滴注。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液(18AA-Ⅶ)：200 ml：20.65 g（总氨基酸）。

儿童复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）

Paediatric Compound Amino Acid Injection (18AA-Ⅰ)

【适应证】儿童、早产儿、低体重儿的肠外营养，余同复方氨基酸注射液（18AA）。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】应按年龄、体重、病情等不同而定。生后12～24小时可以开始应用，肾功能不全者例外。一般开始时15 ml/kg，以后按一日7.5 ml/kg的速度增加，足月儿递增至45 ml/kg，早产儿可增至54 ml/kg，疗程将结束时应逐渐减量，防止产生低血糖症。滴注速度：完全依赖静脉营养支持时，若外周静脉滴注，可将药液稀释后用，全日用量不少于16小时均匀泵入为宜。

【制剂与规格】儿童复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）：① 100 ml : 6.47 g（总氨基酸）；② 250 ml : 16.85 g（总氨基酸）。

儿童复方氨基酸注射液（18AA-Ⅱ）

Paediatric Compound Amino Acid Injection (18AA-Ⅱ)

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同儿童复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）。

【用法与用量】35～50 ml/kg，一日1次或遵医嘱。同儿童复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）。

【制剂与规格】儿童复方氨基酸注射液（18AA-Ⅱ）：① 50 ml : 3.0 g（总氨基酸）；② 100 ml : 6.0 g（总氨基酸）；③ 250 ml : 15.0g（总氨基酸）。

复方氨基酸（19AA-Ⅰ）[保(乙)]

Compound Amino Acid (19AA-Ⅰ)

【适应证】本品为静脉用胃肠外营养输液，用于：①早产儿、低体重儿及各种病因所致不能经口摄入蛋白质或摄入量不足的新生儿；②各种创伤，如烧伤、外伤及手术后等高代谢状态的小儿；③各种不能经口摄食或摄食不足的急、慢性营养不良的小儿，如坏死性小肠结肠炎、急性坏死性胰腺炎、化疗药物反应等。

【注意事项】(1) 肝、肾功能严重障碍者慎用。(2) 应用本品时，需按时监测代谢、电解质及酸碱平衡等，防止并发症。(3) 如发现过敏性皮疹，应立即停药。(4) 静脉滴速不宜过快，20kg儿童一般不宜超过每分钟20滴。(5) 药液开启后一次用完，切勿贮存。(6) 如发生浑浊或沉淀时，不可使用。遇冷析出结晶，可置50～60℃水浴中使溶解并冷至37℃澄明再用。

【禁忌证】(1) 严重氮质血症、肝性脑病、严重肝功能不全患者。(2) 严重肾衰竭或尿毒症患者。(3) 对氨基酸有代谢障碍的患者（本品可能促使氨基酸不平衡）。(4) 对本品过敏者。

【不良反应】(1) 本品输注过快可引起恶心、呕吐、胸闷、心悸、发冷、发热、头痛、面部潮红、多汗、给药部位疼痛。(2) 本品因是高渗溶液，从周围静脉输注时有可能导致血栓性静脉炎。(3) 肝肾功能不全患者可能出现高氨血症和血浆尿素氮的升高。(4) 长期大量输注可能导致胆汁淤积、黄疸，大量快速给药可能引起酸中毒。(5) 偶可发生皮疹样过敏反应（尤其是哮喘患者）、肝功能损害等，应停止给药。

【用法与用量】(1) 采用中心静脉插管或周围静脉给药但均需缓慢滴注。(2) 一日按体重20～35 ml/kg或遵医嘱。(3) 滴注时每克氮应同时供给150～200 kcal非蛋白质热量（葡萄糖、脂肪乳），另加维生素、微量元素等。

【制剂与规格】小儿复方氨基酸注射液(19AA-Ⅰ)：100 ml : 6 g（由19种氨基酸配置成的灭菌水溶液）。

11.1.2.2 肝病用氨基酸

支链氨基酸

Branch Amino Acid

【适应证】用于肝性脑病，也用于肝功能不全时的营养缺乏症。

【注意事项】(1) 儿童、老年人、妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 注意水电解质平衡的监测。(3) 严防微生物的污染，一

旦发现外观异常则不得使用，启用后留存液不宜使用。(4) 气温较低时，宜将溶液加热至接近正常体温再予输注。(5) 重度食管静脉曲张患者，使用本品时应注意控制速度和剂量，以防静脉压过高。(6) 支链氨基酸 3H 注射液可补充支链氨基酸，调节肝病患者的氨基酸代谢紊乱状态，主要用于支链氨基酸与芳香族氨基酸比例失调引起的肝性脑病及各型肝病引起的氨基酸代谢紊乱。(7) 14 氨基酸-800 主要用于肝功能不全合并蛋白营养缺乏症和肝性脑病。每 100 ml 溶液含 14 种氨基酸 8 g，折合含氮量 1.22 g。(8) 本品滴注速度不宜超过每分钟 3 ml。神志清醒后剂量可减半。疗程一般为 10 ~ 15 日。

【禁忌证】氨基酸代谢失调、心功能不全者禁用。

【不良反应】输注速度过快可引起恶心、呕吐、头痛和发热等反应，尤其对危重和老年患者。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：一次 250 ml，一日 2 次，与等量 10% 葡萄糖注射缓慢静脉滴注。(2) 中心静脉滴注：一日量以 0.68 ~ 0.87 g/kg 计，成人剂量相当于一日 500 ~ 750 ml，与 25% ~ 50% 高渗葡萄糖注射液等量混匀后缓慢滴注，每分钟不得超过 40 滴。

【制剂与规格】支链氨基酸 3 H 注射液：250 ml：10.65 g 总氨基酸。

六合氨基酸注射液：250 ml：21.2 g 总氨基酸。

14 氨基酸-800 注射液：250 ml：20.8 g 总氨基酸。

复方氨基酸注射液（3AA）[保(乙)]

Compound Amino Acid Injection (3AA)

【适应证】用于预防和治疗各种原因引起的肝性脑病。

【注意事项】(1) 对重度食管静脉曲张患者应严格控制滴注速度和用量。(2) 有大量胸腔积液、腹水时，避免输入过多。(3) 非肝病使用氨基酸时要注意肝功能和精神症状的出现。(4) 妊娠及哺乳期妇女用药尚不明确。(5) 儿童患者可减量使用。(6) 老年患者易发生过敏反应，使用时应慎重。(7) 其他同复方氨基酸注射液（18AA）。

【禁忌证】严重肾功能障碍或非肝功能障碍导致的氨基酸代谢异常患者禁用。

【不良反应】同复方氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】危重患者一次 250 ml，一日 2 次与等量葡萄糖注射液稀释后缓慢静脉滴注。其他肝病引起的氨基酸代谢紊乱者一次 250 ml，一日 1 次，加等量 10%葡萄糖注射液缓慢静脉滴注。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液（3AA）：250 ml：10.65 g（总氨基酸）。

复方氨基酸（6AA）[保(乙)]

Compound Amino Acid (6AA)

本品为复方制剂，其组分为每 1 000 ml 含 L-缬氨酸 12.2 g、L-亮氨酸 16.6 g、L-异亮氨酸 11.0 g、L-精氨酸 22.0 g、L-谷氨酸 18.6 g、L-门冬氨酸 4.6 g。

【适应证】可用于肝性脑病、慢性迁延性肝炎、慢性活动性肝炎及亚急性与慢性重型肝炎引起的氨基酸代谢紊乱。

【注意事项】(1) 使用前应检查药液，如有浑浊、包装破裂等切勿使用。输注后剩余药液切勿保留，不能再用。(2) 有高度食管和胃底静脉曲张时，输入量不宜过多，速度一定保持在每分钟 40 滴以下，以免静脉压力过高而致破裂出血。(3) 高度腹水、胸腔积液时，应注意水的平衡，避免输入量过多。(4) 本品不加稀释或输注速度过快时可引起患者胸闷、恶心、呕吐，甚至引起呼吸、循环衰竭，表现比较严重，故输注速度宜慢。(5) 本品遇冷易析出结晶，可微温溶解后再使用。(6) 非肝病使用氨基酸时要注意肝功能和精神症状的出现。(7) 使用本品时，应注意水和电解质平衡。(8) 本品系氨基酸类药，儿童患者可减量使用。(9) 老年患者易发生变态反应，使用时应慎重。

【不良反应】输注速度过快可引起恶心、呕吐、头痛和发热等反应，尤其对危重和老年患者多见；反复应用，当再次使用时可引起变态反应，临床表现为发热、恶心、呕吐、低血压、少尿、胸闷、呼吸急促、口唇发绀、腹泻及皮疹；严重者可

致过敏性休克，发生率低，但很难纠正。

【用法与用量】静脉滴注：对紧急或危重患者，一日 2 次，一次 1 瓶，同时与等量 10% 葡萄糖注射液稀释后缓慢静脉滴注，每分钟不超过 40 滴，病情改善后一日 1 瓶，连用 1 周为 1 个疗程；对于其他肝病引起的氨基酸代谢紊乱者，一日 1 次，一次 1 瓶，加等量 10% 葡萄糖注射液缓慢静脉滴注。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液 (6AA)：250 ml ：21.1g（含氨基酸总量 21.1 g，其中支链氨基酸 9.95 g）。

复方氨基酸注射液（17AA-H）

Compound Amino Acids Injection (17AA-H)

【适应证】用于肝性脑病（亚临床、Ⅰ级、Ⅱ级）、高氨血症。能改善症状，但无改善结局的报告。

【注意事项】重度酸中毒患者和充血性心力衰竭患者慎用。本品中含 100 mEq/L 的醋酸根离子，大量给药或与电解质并用时应注意电解质的平衡。余同复方氨基酸注射液（3AA）。

【禁忌证】【不良反应】同复方氨基酸注射液（3AA）。

【用法与用量】静脉滴注：成人一次 500 ml，一日 1 次，输注时间不应少于 180 分钟。根据年龄、症状和体重适当增减。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液 (17AA-H)：500 ml : 37.925 g（总氨基酸）。

复方氨基酸注射液（20AA）[保(乙)]

Compound Amino Acids Injection (20AA)

【适应证】【注意事项】【不良反应】同复方氨基酸注射液（3AA）。

【禁忌证】非肝源性的氨基酸代谢紊乱；肾衰竭伴病理性非蛋白氮；酸中毒；水潴留；休克；余同氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】中心静脉输注：成人推荐平均剂量为一日 7 ~ 9 ml/kg。滴速每小时 1 ml/kg。如外周静脉输注，应将其混入 3 L 袋内滴注。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液 (20AA)：500 ml : 50 g（总氨基酸）。

11.1.2.3 肾病用氨基酸

复方氨基酸注射液（9AA）[保(乙)]

Compound Amino Acid Injection (9AA)

【适应证】急性和慢性肾功能不全患者的肠外营养支持，大手术、外伤或脓毒血症引起的严重肾衰竭以及急慢性肾衰竭。

【注意事项】(1) 用本品的患者，应给予低蛋白，高热量饮食。(2) 输注本品时严格控制给药速度。(3) 定期监测血生化及电解质，必要时检查血镁和血氨。防止血容量异常。(4) 尿毒症患者宜在补充葡萄糖同时给予适量胰岛素，以防出现高血糖。(5) 尿毒症性心包炎、尿毒症脑病、无尿、高钾血症等应首先采用透析治疗。(6) 注意水平衡，防止血容量不足或过多。(7) 余同复方氨基酸注射液（3AA）。

【禁忌证】氨基酸代谢紊乱、严重肝功能损害、心功能不全、中重度水肿、低血钾、低血钠患者。

【不良反应】滴速过快能引起恶心、呕吐、心悸、寒战等反应，应及时减慢速度（每分钟 15 滴为宜）。老年人和危重患者尤其需要注意。余同复方氨基酸注射液（3AA）。

【用法与用量】静脉滴注：成人一日 250 ~ 500 ml，缓慢滴注。进行透析的急、慢性肾衰竭患者一日 1 000 ml，最大剂量不超过 1 500 ml，滴速不超过每分钟 15 滴。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液 (9AA)：250 ml : 13.98 g（总氨基酸）。

复方氨基酸注射液（18AA-N）

Compound Amino Acids Injection (18AA-N)

【适应证】【禁忌证】同复方氨基酸注射液（9AA）。

【注意事项】(1) 有报道出现过高氨血症、意识障碍，如果异常，应即停药。(2) 对慢性肾功能不全非透析患者，每给予本品 200 ml，给药前应相应减少饮食蛋白量 5 ~ 10 g。(3) 余同复方氨基酸注射液（9AA）。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、胸部不适、心悸、全身瘙痒感；罕见皮疹等过敏症状，如发生应停药。对非透析患者，本品可能引起血浆尿素氮升高和碳酸氢根下降。余同复方氨基酸注射液（9AA）。

【用法与用量】(1) 外周静脉给药：用于慢性肾功能不全，成人一次 200 ml，一日 1 次，缓慢静脉滴注；根据年龄、症状和体重适当增减；透析时在透析结束前 60 ~ 90 分钟由透析回路的静脉一侧注入；使用本品时热量给予最好在一日 1 500 kcal 以上。(2) 中心静脉给药：成人一日 400 ml，并根据年龄、症状和体重适当增减。急性肾功能不全：成人一日 400 ml 通过中心静脉持续滴注，并根据年龄、症状和体重适当增减。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液(18AA-N)：200 ml : 11.250 g（总氨基酸）。

11.1.2.4 其他氨基酸

复方氨基酸注射液（15AA）[保(乙)]

Compound Amino Acid Injection (15AA)

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】参见复方氨基酸注射液(18AA)。

【用法与用量】本品可与等量 5% ~ 10%葡萄糖注射液混合或与葡萄糖、脂肪乳、维生素、电解质、微量元素等注射液混合后联合应用（配制过程要严格按照配制程序），经中心或外周静脉输注。将药物稀释后，一般以每分钟 30 ~ 40 滴为宜，中心静脉输液应遵医嘱。输注量应按患者年龄、体重、营养状态、病情不同而定，一般成人一日 250 ~ 750 ml（按氨基酸含量计算为 0.5 ~ 1.0 g/kg)。

【制剂与规格】复方氨基酸注射液(15AA)：250 ml : 17.25 g（总氨基酸）。

丙氨酰谷氨酰胺注射液[保(乙)]

Alanyl-Glutamine Injection

【适应证】用于接受肠外营养时需要补充谷氨酰胺的患者。

【注意事项】(1) 本品使用过程中定期监测患者的肝肾功能和酸碱平衡。(2)对于代偿性肝功能不全的患者，更需定期监测肝功能。(3) 将其他药物加入时要注意其配伍禁忌和相容性。本品中加入其他成分后，不能再贮藏。(4) 孕妇及哺乳期妇女和儿童不推荐使用。

【禁忌证】严重肝肾功能不全患者禁用。

【不良反应】尚未见不良反应的报告。

【用法与用量】不可直接输注，必须与可配伍的氨基酸溶液或含有氨基酸的输液相混合，然后与载体溶液一起输注。1 体积的本品应与至少 5 体积的载体溶液混合，混合液中本品的最大浓度不应超过 3.5%。通过本品供给的氨基酸量一般不超过全部氨基酸供给量的 20%。一日剂量：1.5 ~ 2.0 ml/kg。常用剂量：2.0 ml/kg。加入载体溶液时，用量的参考配比为：如当氨基酸需要量为每日 1.5 g/kg，其中 1.2 g 氨基酸由载体溶液提供，0.3 g 氨基酸由本品提供。输注速度与载体溶液量有关，18 ~ 24 小时均匀输入是常用的办法。使用本品一般不超过 3 周。

【制剂与规格】丙氨酰谷氨酰胺注射液：① 50 ml : 10 g；② 100 ml : 20 g。

精氨酸[保(甲)]

Arginine

【适应证】用于肝性脑病，适用于忌钠的患者，也适用于其他原因引起血氨增高所致的精神症状治疗。肠外营养中可能有增强免疫的功能，但有临床研究报告指出不适用于危重患者。

【注意事项】用药期间宜进行血气和酸碱平衡监测，注意患者的酸碱平衡。危重感染患者的肠外营养中添加精氨酸有报告称可能增加风险，建议遵医嘱使用。

【禁忌证】高氯性酸中毒、肾功能不全及无尿患者禁用。

【不良反应】可引起高氯性酸中毒，以及血中尿素、肌酸、肌酐浓度升高。静脉滴注速度过快会引起呕吐、流涎、皮肤潮红等。

【用法与用量】用前，用 5% 葡萄糖注射液 1 000 ml 稀释后应用。静脉滴注一次 15 ~ 20 g 于 4 小时内滴完。

【制剂与规格】精氨酸：20 ml : 5 g。

11.1.3 多腔袋类肠外营养药

多腔袋类肠外营养制剂能使氨基酸、葡萄糖、脂肪乳、电解质长期稳定不需冷藏地保存在一个容器的各腔室内，需要时可以迅速配制成 “全合一”营养液。特点为：节省混合时间，明显减少微生物和其他杂质的污染、减少医疗和护理差错的可能性。

11.1.3.1 双腔袋类肠外营养药

氨基酸葡萄糖注射液

Amino Acid and Glucose Injection

【适应证】本品为静脉输注营养用药，适用于不能经胃肠摄取营养、经胃肠摄取营养不足或对肠内营养禁忌的患者。

【注意事项】(1) 菌血症患者，高渗性脱水患者，肾衰竭患者，心力衰竭患者，由于梗阻性泌尿系疾病造成尿量减少的患者，糖尿病患者，尿崩症患者，有胰腺功能障碍的患者应慎用。(2) 给药期间，患者的排尿量每日不少于 800 ml。(3) 肠外营养治疗时，如果怀疑严重酸中毒是由于缺乏维生素 B_1 而引起的，应停止肠外营养治疗。(4) 临用前即刻混合，药液浑浊或包装破损时禁止使用。如果两个腔袋之间的隔膜部分已经被打开，不能使用。

【禁忌证】高钠血症、高氯血症、高钾血症、高钙血症、少尿症患者、阿狄森病等患者。高磷酸血症的患者或者甲状旁腺功能减退者（本品电解质成分可能加重高磷酸血症患者的症状）。高镁血症患者或甲状腺功能减退患者。

【不良反应】使用本品后，葡萄糖超负荷综合征偶有报道，肝功异常有少量报道。可能发生严重的酸中毒、高钙血症。大量快速给药可能引起脑水肿、肺水肿、外周水肿或水中毒。由于本品是高浓度葡萄糖制剂，输注时有时可能出现高血糖症、高渗尿糖症和口渴，一旦出现这种情况，需采取相应举措如使用胰岛素。余参见复方氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】根据患者的代谢需要、能量消耗及患者的临床状况选择剂量。滴注速度根据剂量、滴注溶液的性质、24 小时滴注的总液量及输注时间调节。滴注时间应长于 12 小时。建议应该加脂肪乳均匀输入（参考脂肪乳的输入方法）。本品可用作中心静脉营养开始时的初始液，与脂肪乳混输适用于术后患者的低氮低热卡肠外营养。

【制剂与规格】氨基酸葡萄糖注射液：2 000ml/ 袋，每袋含 5.5%平衡氨基酸电解质注射液 1 000 ml，15%葡萄糖电解质注射液 1 000 ml。电解质包括钾、钠、氯、钙、镁、磷酸盐等。

11.1.3.2 三腔袋类肠外营养药

脂肪乳氨基酸 (17) 葡萄糖 (11%) 注射液 [保 (乙)]

Fat Emulsion，Amino Acids (17) and Glucose (11) Injection

【适应证】原则同肠外营养的适应证，如短肠综合征患者和有营养风险的患者。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）和复方氨基酸注射液（18AA）。

【用法与用量】可经周围静脉或中心静脉进行输注。开通腔室间的封条，使三腔内液体混匀，混合液在 25℃下可放置 24 小时。适量添加微量元素及维生素。本品输注速率不宜超过每小时 3.7 ml/kg。推荐输注时间为 12 ～ 24 小时。

【制剂与规格】脂肪乳氨基酸 (17) 葡萄糖（11%）注射液：塑料输液袋装，2 400 ml/ 袋，1 920 ml/ 袋，1 440 ml/ 袋。每袋三腔中分别包装葡萄糖（11%）注射液、氨基酸（17 种）注射液和脂肪乳（长链）注射液。

脂肪乳氨基酸（17）葡萄糖（19%）注射液 [保 (乙)]

Fat Emulsion，Amino Acids (17) and Glucose (19) Injection

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同脂肪乳氨基酸（17）葡萄糖（11%）注射液。

【用法与用量】可用于周围静脉缓慢输入。输注速率不宜超过每小时 2.6 ml/ kg。推荐输注时间为 18 ～ 24 小时。余同

脂肪乳氨基酸(17)葡萄糖(11%)注射液。

【制剂与规格】脂肪乳氨基酸(17)葡萄糖(19%)注射液：塑料输液袋装，2 566 ml/袋，2 053 ml/袋，1 540 ml/袋，1 026 ml/袋。每袋三腔中分别包装葡萄糖(19%)注射液、氨基酸(17种)注射液和脂肪乳(20%长链)注射液。容积渗透压约1 060 mosm/L，pH约5.6。

11.2 肠内营养药

肠内营养(enteral nutrition，EN)是指需少量消化过程或不需消化过程就能吸收的营养液，通过消化道置管(或造口)或少量多次口服的方法，为患者提供所需的营养素。EN的消化和吸收过程能够增加胃肠道的血液供应，刺激内脏神经对消化道的支配和消化道激素的分泌，除为全身和胃肠道本身提供各种营养物质，并能保护胃肠道的正常菌群和免疫系统。这些作用对维持肠黏膜屏障、维持胃肠道正常的结构和生理功能、减少细菌移位，以及预防肝内胆汁淤积均具有重要意义。

EN是一种相对简便、安全、经济和有效的营养支持方法，国内外专家的共识是"当肠道有功能且能安全使用时就应用它"。根据中华医学会肠外肠内营养学分会的指南推荐：肠内营养是首选的营养支持方法，其适应证与肠外营养相似，即需对患者进行"营养风险筛查"，有营养风险的患者，结合临床，制定营养支持计划。

肠内营养药常用于下列具体疾病：①意识障碍及昏迷患者，如老年痴呆不能经口进食和精神失常或不愿经口进食的患者；②吞咽困难和失去咀嚼能力的患者；③严重创伤、大面积烧伤、多发性骨折及各种原因所致的严重感染等患者；④适宜用肠内营养的胃肠道瘘患者；⑤适宜用肠内营养的溃疡性结肠炎及克罗恩病患者；⑥消化吸收不良患者，如慢性胰腺功能不全及短肠综合征的患者；⑦营养不良(营养不足)的患者，如恶性肿瘤或慢性消耗性疾病；⑧器官衰竭患者，如心力衰竭、肝衰竭、胃肠功能衰竭、肾衰竭及多器官衰竭等。对这类患者的肠内营养支持应慎重；⑨特殊患者营养支持，如有并发症的糖尿病、急性放射病、器官移植等；⑩家庭肠内营养支持患者。

接受完全肠内营养支持的患者，指南推荐首选管饲的方法，其中鼻胃(肠)管适用于短期喂养(2～3周)的患者，但需注意预防吸入性肺炎；空肠造口适用于接受腹部手术且术后需要较长时间肠内营养的患者；非腹部手术患者，若需接受较长时间(2～3周以上)的肠内营养，如严重头外伤，经皮内镜下胃造口(PEG)是首选的管饲途径。EN输注泵的使用有利于控制滴速、控制血糖和减少消化道不适症状。

肠内营养药从临床使用的角度可以分为通用型肠内营养药和疾病特异型肠内营养药(又称疾病适用型营养药)。

肠内营养药按氮源分为3大类：氨基酸型、短肽型(前两类也称为成分型)、整蛋白型(也称为非成分型)。此外，尚有组件型制剂，如氨基酸/短肽/整蛋白组件、糖类制剂组件、长链(LCT)及中长链脂肪(MCT/LCT)制剂组件、维生素制剂组件和ω-3脂肪酸组件等。

氨基酸型肠内营养药主要为低脂的粉剂，可减少对胰腺外分泌系统和消化液分泌的刺激。短肽型肠内营养药所含的蛋白质为蛋白水解物，营养液中的短肽可经小肠黏膜刷状缘的肽酶水解后进入血液，容易被机体利用。整蛋白型肠内营养药进入胃肠道后可刺激消化腺体分泌消化液，帮助消化和吸收。疾病特异型(又称疾病适用型)肠内营养药目前临床有糖尿病型(如TPF-D)、肿瘤适用型(如TPF-T)、高能量高蛋白型(如TP-HE)、免疫增强型和肺病型(如Ⅱ-TP)等。

选择肠内营养制剂时应考虑以下因素：①患者的年龄；②胃肠道功能；③脂肪吸收状况：对于脂肪吸收不良或乳糜胸腹水的患者，由于中长链脂肪酸的代谢特点，以中链三酰甘油代替长链三酰甘油为宜；④糖的耐受情况：有些患者糖耐量降低或不能耐受乳糖；⑤患者疾病情况：对于有肝、肾、肺等脏器功能障碍和先天性代谢缺陷的患者，应选择相应的组件式肠内营养，以避免出现代谢并发症。

11.2.1 通用型肠内营养药

11.2.1.1 氨基酸型肠内营养药

肠内营养粉（AA）

Enteral Nutritional Powder (AA)

【适应证】与肠内营养的适应证基本相同。但更侧重于消化道仅有部分功能的患者，如术后吻合口瘘（咽部瘘、食管瘘、胃瘘、结肠瘘等）、胰腺炎的恢复期、短肠综合征的患者（小肠的长度短于60 cm）；炎性肠道疾患（克罗恩病、溃疡性结肠炎）等。

【注意事项】(1) 非供静脉使用，请依医师或营养师指示使用；不宜用于10岁以下儿童。(2) 不得用50℃以上的热水配制营养药；糖尿病患者应注意控制和监测血糖。(3) 肝肾功能异常者慎用。(4) 本品可室温保存，配制好的制剂可在室温下贮藏8小时，配制后冰箱中4℃下冷藏可贮藏48小时。

【禁忌证】肠梗阻及肠功能紊乱的患者忌用。

【不良反应】少见腹胀、腹痛和腹泻。

【用法与用量】配制300 ml全浓度本品方法如下：将250 ml温水倒入适量容器中，加入1袋（80.4 g）本品，盖上盖振荡20秒，静置5～10分钟后，颗粒充分溶解后使用。(1) 成人常用量：管饲连续滴入第1日先用80.4 g/袋，化水300 ml，1小时20 ml，根据患者消化道情况逐日增加至维持一日5～6包。(2) 口服80.4 g/袋，化水300 ml，1小时50 ml。一般口服只能达到2袋，很难达到全量。

【制剂与规格】肠内营养粉（AA）：本品为原味粉剂，易溶于水，pH为5.3。其主要成分为结晶氨基酸、脂质、糖类、电解质、维生素和微量元素等。每包80.4 g（300 ml），总能量为300 kcal，能量密度为1 kcal/ml。

谷氨酰胺颗粒

Glutamine Granules

【适应证】用于需要补充谷氨酰胺患者的肠内营养补充药。谷氨酰胺为肠黏膜修复和免疫细胞增殖所需要的营养素。

【注意事项】对于代偿性肝功能不全的患者，定期监测肝功能。本品中加入肠内营养药后，24小时内使用。其水溶液在室温中每日分解量为1%～2%。

【禁忌证】严重肝肾功能不全患者忌用。

【不良反应】尚未见不良反应的报告。

【用法与用量】一日15～30 g，加入肠内营养药中均匀输入。也可根据医嘱口服：成人一次5～10 g，一日3次；儿童每千克体重一次0.1～0.2 g，一日3次。温开水溶解后服用，即配即用。

【制剂与规格】谷氨酰胺颗粒剂：2.5 g（袋）。

复方氨基酸胶囊（8-11）

Compound Amino Acid Capsules

【适应证】用于低蛋白血症的辅助治疗。

【注意事项】尚不明确。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】尚未见不良反应的临床报道。

【用法和剂量】口服，每次1～2粒，一日2～3次，或遵医嘱，小儿一日1～3粒，或遵医嘱，可取胶囊内容物用温开水送服。

【制剂与规格】胶囊剂本品为复方制剂。

11.2.1.2 α-酮酸

配合低蛋白饮食，预防和治疗因慢性肾功能不全造成蛋白质代谢失调引起的损害。口服，成人一次4～8片（复方α-酮酸片，每片0.63 g），一日3次，用餐期间整片吞服。对于肾小球滤过率低于每分钟20 ml的患者，本品配合一日不超过40 g（成人）的低蛋白饮食，可长期服用。(其他见8.7.2)

11.2.1.3 短肽型肠内营养药

肠内营养混悬液（SP）

Enteral Nutritional Suspension (SP)

【适应证】用于有胃肠功能或有部分

胃肠道功能有营养风险的住院病人。主要用于：①代谢性胃肠道功能障碍（胰腺炎、肠道炎症性疾病、放射性肠炎和化疗、肠瘘、短肠综合征、艾滋病）；②危重疾病（大面积烧伤、创伤、脓毒血症、大手术后的恢复期）；③营养不良病人的手术前喂养；肠道准备。

【注意事项】(1) 不能经静脉输注。(2) 严重糖代谢异常的患者慎用。(3) 严重肝肾功能不全的患者慎用。

【不良反应】使用本品可能会出现腹泻、腹痛等胃肠道不适反应。

【禁忌证】胃肠道功能衰竭；完全性小肠梗阻；严重的腹腔内感染；对本品中任一成分过敏的患者；对本品中任一成分有先天性代谢障碍的患者；顽固性腹泻等需要进行肠道休息处理的患者。

【用法与用量】口服或肠道喂养。置入一根喂养管到胃、十二指肠或空肠上段部分，连接喂养管与本品容器。本品能量密度为 1 kcal/ml，正常滴速为每小时 100 ~ 125 ml（开始时滴速宜慢）。(1) 一般病人，一日给以 2 000 kcal（4 袋），即可满足机体对营养的需求。(2) 高代谢病人（烧伤，多发性创伤），一日 4 000 kcal（8 袋）。(3) 初次肠道喂养的病人，初始剂量从 1 000 kcal（2 袋）开始，在 2 ~ 3 日逐渐增加至需要量。

【制剂与规格】肠内营养混悬液：500 ml。

短肽型肠内营养粉剂[保(乙)]

Short Peptide Enteral Nutrition Powder

【适应证】【不良反应】同氨基酸型肠内营养药。

【禁忌证】不能用于 5 岁以内的婴幼儿。余同氨基酸型肠内营养药。

【注意事项】非供静脉使用，请遵医嘱使用；妊娠及哺乳期妇女用药具体使用由医生处方决定。

【用法与用量】混悬剂打开前先摇匀，适应全浓度输注无需稀释。操作中注意洗手，避免交叉感染。粉剂在容器中注入 50 ml 温开水，加入 1 袋，充分混匀；待粉剂完全溶解后，再加温开水至 500 ml，轻轻搅拌混匀即可。具体用法：①一般病人，一日给予 2 000 kcal（4 袋），即可满足机体对营养的需求；②高代谢病人（烧伤，多发性创伤），一日 4 000 kcal（8 袋）；③初次肠道喂养的病人，初始剂量从 1 000 kcal（2 袋）开始，在 2 ~ 3 日逐渐增加至需要量。

【制剂与规格】短肽型肠内营养粉剂：为微黄色至黄色粉末，略带芳香气味，易溶于水，形成乳状液体，味略苦涩。pH 为 6.0 左右。其主要成分为：麦芽糊精、水解乳清蛋白、植物油、中链三酰甘油（MCT）、乳化剂、稳定剂、矿物质、维生素和微量元素等，能量密度为 1 kcal/ml。

短肽型肠内营养混悬剂：主要成分为水、麦芽糊精、乳清蛋白水解物、植物油、矿物质、维生素和微量元素等人体必需的营养要素。

11.2.1.4 整蛋白型肠内营养药

肠内营养乳剂（TP）

Enteral Nutritional Emulsion (TP)

【适应证】同肠内营养的适应证。本品不含膳食纤维，可用于严重胃肠道狭窄和肠瘘患者。

【注意事项】(1) 对于以本品为唯一营养来源的患者，必须监测其液体平衡。(2) 应根据患者不同的代谢状况决定是否需要另外补钠。(3) 本品提供长期营养时，只适用于禁用膳食纤维的患者。否则应选用含纤维的营养制剂。(4) 使用前摇匀。有效期内使用。(5) 处于妊娠期初期 3 个月的妇女和育龄妇女一日摄入维生素 A 不应超过 10 000 U。本品与含维生素 A 的其他营养制剂一起使用时，应考虑这一因素。(6) 25℃以下密闭保存。开启后冷处（2 ~ 10℃）保存 24 小时。

【禁忌证】不可应用于消化道功能严重障碍和对本品所含营养物质有先天性代谢障碍，以及 1 岁以下婴儿。禁忌静脉内输入。

【不良反应】输注过快或严重超量时，可能出现恶心、呕吐或腹泻等胃肠道反应。

【用法与用量】本品通过管饲或口服使用，应按照患者体重和营养状况计算

每日剂量。(1) 以本品为唯一营养来源的患者：推荐剂量为按体重一日 30 ml (30 kcal)/kg。(2)以本品补充营养的患者：根据患者需要，一日使用 500～1 000 ml。管饲给药时，应逐渐增加剂量，第 1 日滴速为 1 小时 20 ml，以后逐日增加 1 小时 20 ml，最大滴速 1 小时 125 ml。

【制剂与规格】肠内营养乳剂（TP）：为浅灰黄色至淡棕色含有固体混悬物的乳剂，每 500 ml 含蛋白质 19 g、脂肪 17 g、糖类 69 g，以及钠、钾、氯、钙等电解质、多种维生素和微量元素，提供 500 kcal 热量，能量密度为 1 kcal/ml。

肠内营养粉剂（TP）

Enteral Nutritional Powder (TP)

【适应证】同肠内营养的适应证。

【注意事项】同肠内营养乳剂（TP）。如不耐受果糖患者及对牛乳或大豆蛋白过敏者慎用。

【不良反应】同肠内营养乳剂（TP）。

【禁忌证】同肠内营养乳剂（TP）。半乳糖血症患者禁止使用。

【用法与用量】同肠内营养输注的基本原则。混合方法：在杯中加入本品 55.8 g，用温开水 200 ml，缓慢地搅拌直到溶解为 250 ml，400 g 粉剂分 7 份。可口服或管饲，遵照医嘱使用。管饲：根据患者的病情和耐受性调整滴速、用量和浓度。额外需要的液体应通过每餐和两餐之间给予温水补足，连续管饲时，给药速度应从 20 ml/h 增至正常速度。一日输注前检查胃内残留物，如胃液＞ 100 ml，应注意调整速度。间歇管饲时，如果患者仍不能忍受可将配方稀释。同时也要定期检查胃内残留物，根据情况调整灌注。

【制剂与规格】肠内营养粉剂（TP）为淡黄色粉末，气芳香、味甜。每听 400 g，可加水溶解为 1 750 ml，提供 1 750 kcal 热量，能量密度为 1 kcal/ml。含有蛋白质、糖类、脂肪、维生素和矿物质，不含麸质。本品具有渗透性，重量毫渗量为 443 mOsm/kg 水，容积毫渗量为 379 mOsm/L，因此只要正确使用就不会引起因渗透压导致的腹泻。热氮比为 177：1，非蛋白热氮比为 152：1。

肠内营养乳剂（TPF）

Enteral Nutritional Emulsion (TPF)

【适应证】同肠内营养适应证，尤其是不能耐受大容量喂养或需要高能量的患者。本品含丰富的膳食纤维，有利于维持患者肠道结构和功能，适于长期应用。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】【用法与用量】同肠内营养乳剂（TP）。

【制剂与规格】肠内营养乳剂（TPF)：为浅灰黄色至淡棕色的含有固体混悬物的乳剂。每 500 ml 中的主要成分包括蛋白质 28 g，脂肪 29 g，糖类 94 g，膳食纤维 10 g，电解质、多种维生素和微量元素等，能量密度为 1.5 kcal/ml。

肠内营养混悬液（TPF）

Enteral Nutritional Suspension (TPF)

【适应证】同肠内营养适应证。

【注意事项】(1) 不宜用于要求低渣膳食的病人。(2) 严禁静脉输注。(3) 在使用过程中，需注意液体平衡，保证足够的液体输入，以补充由纤维素排泄所带走的水分。(4) 严重糖代谢异常的患者慎用。(5) 严重肝肾功能不全的患者慎用。

【禁忌证】肠道功能衰竭；完全性肠梗阻；严重腹腔内感染；对本品中任一成分过敏；对本品中任一成分有先天性代谢障碍。

【不良反应】可能出现腹泻、腹痛等胃肠道不适反应。

【用法与用量】口服或管饲喂养。管饲喂养时，先置入一根喂养管到胃、十二指肠或空肠上段部分，连接喂养管与本品容器。本品能量密度为 1 kcal/ml，正常滴速为每小时 100 ～ 125 ml (开始时滴速宜慢)。(1) 一般病人，一日给予 2 000 kcal，即可满足机体对营养的需求。(2) 高代谢病人（烧伤，多发性创伤），一日 4 000 kcal。(3) 初次肠道喂养的病人，初始剂量从 1 000 kcal 开始，在 2 ～ 3 日逐渐增加至需要量。(4) 若病人不能摄入过多的液体，如心肾功能不全患者，可酌情使用能量密度为 1.5 kcal/ml 的产品。

【制剂与规格】肠内营养混悬液（TPF)：本品为灰白色至微黄棕色乳状混

悬液，含膳食纤维，味微甜。每 500 ml 含蛋白质，脂肪，糖类，膳食纤维（11 g），以及钠、钾、氯、钙等电解质和多种维生素。有 0.75 kcal/ml、1 kcal/ml、1.5 kcal/ml 3 种能量密度。

整蛋白型肠内营养剂（粉剂）[保(乙)]

Intacted Protein Enteral Nutrition Powder

【适应证】【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同肠内营养粉剂（TP）。

【用法与用量】同肠内营养输注的基本原则。混合方法：在容器中注入 500 ml 温开水，加入 320 g 粉剂，充分混合。待粉剂完全溶解后，再加温开水至 1 500 ml，轻轻搅拌混匀；或用所附的小匙，取 9 平匙，溶于 50 ml 温开水中充分混合，待完全溶解后，加温开水至 200 ml 以满足少量使用的要求。具体用法为：①口服：一次 50 ml/ 小时。②管饲喂养：先置入一根喂养管到胃、十二指肠或空肠上段部分，连接喂养管与本品容器。正常滴速为每小时 100 ~ 125 ml（开始时滴速宜慢）。一般病人，一日给以 2 000 kcal，即可满足机体对营养的需求；高代谢病人（烧伤，多发性创伤），一日 4 000 kcal。③初次肠道喂养的病人，初始剂量从 1 000 kcal 开始，在 2 ~ 3 日逐渐增加至需要量。

【制剂与规格】整蛋白型肠内营养剂（粉剂）：为微黄色至黄色粉末，味微甜，有纯正香草芳香，每听 320 g，加水混合易成白色乳状液体 1 500 ml，提供 1 500 kcal 热量。主要成分麦芽糊精、酪蛋白、植物油、矿物质、维生素和微量元素等。

11.2.2 疾病特异型肠内营养药

肠内营养乳剂（TPF-D）

Enteral Nutritional Emulsion (TPF-D)

【适应证】同肠内营养的适应证，适用于有糖尿病或糖耐量异常的患者。

【注意事项】(1) 必要时按照本品的用法来适当调节降糖药用量，尤其是本品的用量和给予的时间有变化时。(2) 对非胰岛素依赖的糖尿病患者，最好采用持续管饲或将每日用量分成几个小部分的方法给药。(3) 对手术后和创伤后的糖尿病患者应做相应的代谢检查。应保证足够的液体补充，如饮水或输液。(4) 本品含钠较低，可以满足糖尿病患者的需要。但单用本品补充营养时，应适当补充钠。(5) 使用前摇匀，有效期内使用。

【禁忌证】【不良反应】同肠内营养乳剂（TP）。

【用法与用量】本品通过管饲或口服使用，应按照患者体重和消耗状况计算每日剂量。(1) 以本品为唯一营养来源的患者：推荐剂量为一日 30 ml/kg，平均剂量为一日 2 000 ml（1 800 kcal）。(2) 以本品补充营养的患者：根据患者需要，一日使用 500 ml（450 kcal）。管饲给药时，应逐渐增加剂量，第 1 日滴速为 1 小时 20 ml，以后逐日增加 1 小时 20 ml，最大滴速 1 小时 125 ml。

【制剂与规格】肠内营养乳剂（TPF-D）：为淡黄色或淡棕色乳状液，能为糖尿病患者提供所需的各种营养，包括蛋白质、脂肪、糖类、维生素、矿物质、微量元素和膳食纤维，能量密度为 0.9 kcal/ml。其中糖类主要来源于木薯淀粉和谷物淀粉，因此能减少糖尿病患者与糖耐受不良患者的葡萄糖负荷。本品不含牛奶蛋白，适用于对牛奶蛋白过敏的患者。

肠内营养混悬液（TPF-D）

Enteral Nutritional Suspension (TPF-D)

【适应证】同肠内营养适应证，适用于糖尿病患者。

【注意事项】【不良反应】同肠内营养乳剂（TPF-D）。

【禁忌证】本品不适用于半乳糖血症患者和对牛奶或大豆蛋白质敏感的患者。余同肠内营养乳剂（TP）。

【用法与用量】本品可以管饲也可以口服，但需要遵医嘱进行。选择合适的管饲方法可以帮助确保患者耐受该配方，满足患者对热量和营养素的需求，以控制好血糖。不论使用何种管饲方法，胰岛素和

(或) 口服降糖药物的剂量和使用方法须随管饲方法的改变而调整。持续管饲是糖尿病患者较好的选择，因为持续超过24小时给予营养素可能会提高血糖的控制水平并降低胰岛素需要量。对应用管饲进行营养支持的患者重点监测血糖和水电解质平衡。余同肠内营养使用的基本原则。

【制剂与规格】肠内营养混悬液(TPF-D)：为浅棕黄色不透明溶液，具牛奶香草样气味。其成分为蛋白质、脂肪、糖类、维生素、矿物质。能量密度1 kcal/ml。

肠内营养乳剂 (TPF-T)

Enteral Nutritional Emulsion (TPF-T)

【适应证】适用于营养不良的肿瘤患者。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】同肠内营养乳剂（TP)。

【用法与用量】通过管饲或口服使用，应按照患者体重和营养状况计算一日剂量。(1) 本品为唯一营养来源的患者：患者非恶病质时，推荐剂量为一日 20 ~ 25 ml/kg（约30 kcal/kg)；对于恶病质患者，推荐剂量为按每小时 30 ~ 40 ml/kg（40 ~ 50 kcal/kg)。(2) 以本品补充营养的患者：推荐剂量为每小时 400 ~ 1 200 ml（520 ~ 1 560 kcal）/kg。(3) 管饲给药时，应逐渐增加剂量，第1日滴速为1小时20 ml，以后逐日增加1小时20 ml，最大滴速1小时100 ml。

【制剂与规格】肠内营养乳剂（TPF-T)：为淡黄色至深黄色乳状液体，分别有4种不同的味道，淡蘑菇香味（香草口味)、淡水果香味（水果口味)、淡蔬菜香味（蔬菜口味)、淡谷味（中性口味)，4种不同味道的乳剂成分基本相似。渗透压分别为：香草口味 330 mOsm/L、水果口味 350 mOsm/L、蔬菜口味 330 mOsm/L、中性口味 390 mOsm/L。能量密度1.3 kcal/ml。

肠内营养乳剂（TP-HE)

Enteral Nutritional Emulsion (TP-HE)

【适应证】同肠内营养适应证，需高蛋白摄入患者。

【注意事项】(1) 以本品提供全部营养的患者，应监测液体平衡。(2) 根据个体代谢状态，决定是否需要额外补充钠。(3) 以本品提供长期营养时，适用于禁用膳食纤维的患者，否则应选用含膳食纤维的营养制剂。余同 EN 使用基本原则。

【禁忌证】【不良反应】同肠内营养乳剂（TP)。

【用法与用量】可通过管饲或口服使用，遵循 EN 基本使用原则。补充营养的患者：一日使用 500 ml（750 kcal)。

【制剂与规格】肠内营养乳剂（TP-HE)（浅黄色或浅棕色乳剂)：500 ml。每500 ml 的主要成分包括：蛋白质 37.5 g，脂肪 29 g（饱和脂肪酸 17.5 g，多不饱和脂肪酸 8 g，中链三酰甘油 16.5 g)，糖类 85 g，电解质、维生素和微量元素等。渗透压 300 mOsm/L，能量密度 1.5 kcal/ml。

肠内营养混悬液 II （TP)

Enteral Nutritional Suspension II (TP)

【适应证】适用于慢性阻塞性肺部疾病。

【注意事项】肾功能不全，肝性脑病，特殊代谢紊乱，如不耐受果糖等患者慎用，余同肠内营养乳剂（TP)。

【禁忌证】【不良反应】同肠内营养乳剂（TP)。

【用法与用量】同肠内营养乳剂(TP)。本品可口服作为全营养单独使用或和食物同时使用或在两餐间作为营养补充给予。

【制剂与规格】肠内营养混悬液 II (TP)（为浅棕黄色不透明的溶液，具牛奶香草样气味)：① 237 ml；② 1 000 ml。

免疫增强型肠内营养乳剂

Enteral Nutrition Emulsion (Immuno-enhanced)

【适应证】同肠内营养的适应证，适用于手术后患者。

【注意事项】不建议用于需要免疫抑制的患者；危重症感染性患者慎用。余同肠内营养乳剂（TP)。

【禁忌证】【不良反应】【用法与用量】

同肠内营养乳剂（TP）。

【制剂与规格】免疫增强型肠内营养乳剂（乳黄色至浅黄棕色乳状混悬液）：①250 ml；② 500 ml。主要成分包括精氨酸、ω-3 多不饱和脂肪酸和核糖核酸等可改善机体免疫功能的营养素，含水解玉米淀粉，酪蛋白酸钠及钙，棕榈仁油，L-精氨酸，纤维素凝胶，枸橼酸钠，氯化镁，羟化大豆卵磷脂，磷酸氢二钾，矿物质和维生素微量元素等。能量密度 1 kcal/ml。

11.3 水、电解质、酸碱平衡药

多种疾病在其发生、发展过程中常出现水、电解质和酸碱平衡失常，出现相应的临床表现，有些甚至危及生命，必须及时予以纠正。对于摄入不足患者，若经过营养风险筛查不需要营养支持，合理、安全、简便的水电解质补充及酸碱失衡纠正是最基础的治疗。

11.3.1 水、电解质补充药

葡萄糖注射液[基(基)，保(甲)]

Glucose Injecfion

【适应证】用于补充能量和体液；低血糖症；高钾血症；高渗溶液用作组织脱水药；配制腹膜透析液。

【注意事项】(1) 倾倒综合征及低血糖反应（胃大部分切除患者做口服糖耐量试验时易出现，应改为静脉葡萄糖试验）。(2) 应用高渗葡萄糖溶液时选用大静脉滴注。(3) 妊娠及哺乳期妇女用药：分娩时注射过多葡萄糖，可刺激胎儿胰岛素分泌，发生产后婴儿低血糖。(4) 儿童及老年患者用药：补液过快、过多，可致心悸、心律失常，甚至急性左侧心力衰竭。(5) 水肿及严重心肾功能不全、肝硬化腹水者，易致水潴留，应控制输注量，心功能不全者尤其应该控制滴速。

【禁忌证】糖尿病酮症酸中毒未控制者；高血糖非酮症性高渗状态。

【不良反应】静脉炎；高浓度葡萄糖注射液外渗可致局部肿痛；反应性低血糖；高血糖非酮症昏迷；长期单纯补给葡萄糖时易出现低钾、低钠及低磷血症；原有心功能不全者补液过快可致心悸、心律失常，甚至急性左心衰竭；1 型糖尿病患者应用高浓度葡萄糖时偶有发生高钾血症。

【用法与用量】补充热能，患者因某些原因进食减少或不能进食时，应根据所需热能计算葡萄糖用量，一般可给予 10%～25%葡萄糖注射液静脉滴注，并同时补充体液。静脉营养治疗时，在非蛋白质热能中，葡萄糖供能＞脂肪供能，必要时每 5 ～ 10 g 葡萄糖加入胰岛素 1 U。低血糖症重者可予以 50% 葡萄糖静脉注射。

【制剂与规格】葡萄糖注射液：① 10 ml : 0.5 g；② 20 ml : 1 g；③ 500 ml : 25 g；④ 500 ml : 50 g；⑤ 500 ml : 125 g；⑥ 20 ml : 10 g；⑦ 100 ml : 50 g；⑧ 250 ml : 125 g。

果糖[保(乙)]

Fructose

【适应证】(1) 注射剂的稀释剂。(2) 用于烧创伤、术后及感染等胰岛素抵抗状态下或不适宜使用葡萄糖时需补充水分或能源的患者的补液治疗。

【注意事项】(1) 警告：使用时应警惕本品过量使用有可能引起危及生命的乳酸性酸中毒，未诊断的遗传性果糖不耐受症患者使用本品时可能有致命的危险。(2) 肾功能不全者、有酸中毒倾向患者慎用。(3) 本品过量使用可引起严重的酸中毒，故不推荐肠外营养中替代葡萄糖。(4) 使用过程中应监测临床和试验室指标以评价体液平衡、电解质浓度和酸碱平衡。(5) 慎用于预防水过多和电解质紊乱。(6) 过量输注无钾果糖可引起低钾血症。本品不用于纠正高钾血症。(7) 本品能加剧甲醇氧化成甲醛，故本品不得用于甲醇中毒治疗。(8) 本品注射速度宜缓慢，以不超过每小时 0.5 g/kg 为宜。

【禁忌证】遗传性果糖不耐受症、痛风和高尿酸血症患者禁用。

【不良反应】(1) 循环和呼吸系统：过量输入可引起水肿，包括周围水肿和肺水肿。(2) 内分泌和代谢：滴速过快（每小时≥ 1 g/kg）可引起乳酸性酸中毒、高尿酸血症以及脂代谢异常。(3) 电解质紊乱：稀释性低钾血症。(4) 胃肠道反应：偶有

上腹部不适、疼痛或痉挛性疼痛。(5) 偶有发热、荨麻疹。(6) 局部不良反应包括注射部位感染、血栓性静脉炎等。

【用法与用量】缓慢静脉滴注，一般一日 5% ~ 10% 果糖注射液 500 ~ 1 000 ml。剂量根据患者的年龄、体重和临床症状调整。

【制剂与规格】果糖注射液：①250 ml：12.5 g；②250 ml：25 g；③ 500 ml：25 g；④ 500 ml：50 g。

转化糖[保(乙)]

Invert Sugar

【适应证】药物稀释剂。适用于需要非口服途径补充水分或能源的患者补液治疗。尤其是糖尿病患者的能量补充剂。烧伤、创伤、术后及感染等胰岛素抵抗（糖尿病状态）患者的能量补充剂。药物中毒、酒精中毒。

【注意事项】(1) 严重肝病患者、肾功能不全患者、有酸中毒倾向以及高尿酸血症患者慎用；糖尿病患者不宜过多输注。(2) 本品过量使用或不正确使用有可能引起严重的酸中毒，故不推荐肠外营养中完全替代葡萄糖。(3) 水肿及严重心功能不全者应严格控制输液量。(4) 本品不得用于甲醇中毒治疗，因其能加剧甲醇氧化成甲醛。(5) 本品启封存后立即使用，输液后的剩余药液切勿贮藏再用。(6) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(7) 未诊断的遗传性果糖不耐受症患者使用本品可能有致命的危险。

【禁忌证】遗传性果糖不耐受患者禁用，痛风和高尿酸血症者禁用。

【不良反应】可能会引起面部潮红，风疹、发热等变态反应。大剂量、快速输注可能导致乳酸中毒和高尿酸血症。长期单纯使用可引起电解质紊乱。

【用法与用量】静脉滴注，用量视病情需要而定。成人常用量为一次 250 ~ 1 000 ml。滴注速度应低于每小时 0.5 g/kg（以果糖计）。

【制剂与规格】转化糖注射液：① 500 ml，内含葡萄糖 25 g、果糖 25 g；② 250 ml：果糖 12.5 g 与葡萄糖 12.5 g；③ 250 ml：果糖 6.25 g 与葡萄糖 6.25 g。

氯化钠注射液[基(基)，保(甲)]

Sodium Chloride Injecfion

【适应证】用于各种原因所致的低渗性、等渗性和高渗性失水，高渗性非酮症糖尿病昏迷，低氯性代谢性碱中毒。外用可冲洗眼部、伤口等。浓氯化钠主要用于各种原因所致的水中毒及严重的低钠血症。

【注意事项】(1) 下列情况慎用，如水肿性疾病，如肾病综合征，肝硬化，腹水，充血性心力衰竭，急性左侧心力衰竭，脑水肿及特发性水肿等；急性肾衰竭少尿期，慢性肾衰竭尿量减少而对利尿药反应不佳者；高血压；低钾血症。(2) 根据临床需要，检查血清中钠、钾、氯离子浓度；血液中酸碱浓度平衡指标，肾功能及血压和心肺功能。(3) 儿童用药及老人用药：补液量和速度应严格控制。(4) 浓氯化钠不可直接静脉注射或滴注，应加入液体稀释后应用。

【禁忌证】妊娠高血压者。

【不良反应】输液容量过多和滴速过快，可致水钠潴留，引起水肿、血压升高、心率加快、胸闷、呼吸困难、急性左侧心力衰竭。不适当给予高渗氯化钠可致高钠血症。过多、过快输注低渗氯化钠，可致溶血及脑水肿。

【用法与用量】(1) 高渗性失水。所需补液总量 (L) = [血钠浓度 (mmol/L) − 142]/ 血钠浓度 (mmol/L) × 0.6 × 体重 (kg)，第 1 日补给半量，余量在以后 2 ~ 3 日补给，并根据心肺肾功能酌情调节。在治疗开始的 48 小时内，血 Na^+ 浓度每小时下降不超过 0.5 mmol/L。若患者存在休克，应先予氯化钠注射液，并酌情补充胶体，待休克纠正，血钠 > 155 mmol/L，血浆渗透浓度 > 350 mOsm/L，可予低渗氯化钠注射液。待血浆渗透浓度 < 330 mOsm/L，改用 0.9% 氯化钠注射液。(2) 等渗性失水。原则给予等渗溶液，但应注意防止高氯血症出现。(3) 低渗性失水。血钠低于 120 mmol/L 或出现中枢神经系统症状时，给予 3% ~ 5% 氯化钠注射液缓慢滴注，在 6 小时内将血钠浓度提高至 120 mmol/L 以上。待血钠回升至

120 ~ 125 mmol/L 以上，可改用等渗溶液或等渗溶液中酌情加入高渗葡萄糖注射液或 10% 氯化钠注射液。(4) 低氯性碱中毒。给予 0.9% 氯化钠注射液或复方氯化钠注射液（林格液）500 ~ 1 000 ml，以后根据碱中毒情况决定用量。

【制剂与规格】氯化钠注射液：① 50 ml : 0.45 g；② 100 ml : 0.9 g；③ 250 ml : 2.25 g；④ 500 ml : 4.5 g；⑤ 1 000 ml : 9 g。浓氯化钠注射液：10 ml : 1 g。

复方氯化钠注射液（林格液）：100 ml 含氯化钠 0.85 g、氯化钾 0.03 g、氯化钙 0.003 g。① 250 ml；② 500 ml；③ 1 000 ml。

乳酸钠林格注射液：500 ml 内含氯化钠 1.5 g、氯化钾 0.75 g、氯化钙 0.05 g、乳酸钠 1.55 g。

氯化钾 [基（基）、保（甲）]

Potassium Chloride

【适应证】用于预防和治疗低钾血症，治疗洋地黄中毒引起的频发性、多源性期前收缩或快速心律失常。

【注意事项】(1) 本品严禁直接静脉注射。(2) 下列情况慎用：急性脱水；代谢性酸中毒伴有少尿时；慢性肾功能不全；家族性周期性麻痹（低钾性麻痹应给予补钾，但需鉴别高钾性或正常性周期麻痹）；肾前性少尿；传导阻滞性心律失常，尤其应用洋地黄类药物时；大面积烧伤、肌肉创伤、严重感染、大手术后 24 小时和严重溶血等可引起高钾血症情况；肾上腺性异常综合征伴盐皮质激素分泌不足；接受保钾利尿药的患者；胃肠道梗阻、慢性胃炎、溃疡病、食管狭窄、憩室、肠张力缺乏，以及溃疡性结肠炎患者。(3) 用药期间需做以下随访检查：血钾、血镁、血钠、血钙、酸碱平衡指标、心电图、肾功能和尿量。(4) 妊娠期妇女用药资料尚不明确，动物实验未见补钾对妊娠动物有不良作用。(5) 老年人肾脏清除 K^+ 功能下降，应用钾盐时较易发生高钾血症。

【禁忌证】高钾血症者、急慢性肾功能不全者忌用。

【不良反应】(1) 本品可刺激静脉内膜引起疼痛。(2) 滴注速度较快、应用过量或原有肾功能损害时，应注意发生高钾血症。(3) 口服偶见胃肠道刺激症状，如恶心、呕吐、咽部不适、胸痛（食管刺激）、腹痛、腹泻，甚至消化性溃疡及出血。在空腹、剂量较大及原有胃肠道疾病者更易发生。

【用法与用量】(1) 静脉滴注。成人：①一般用法，将 10% 氯化钾注射液 10 ~ 15 ml 加入 5% 葡萄糖注射液 500 ml 中滴注（忌直接静脉滴注与注射）。一般补钾浓度不超过 3.4 g/L（45 mmol/L），速度不超过每小时 0.75 g（每小时 10 mmol），一日补钾量为 3 ~ 4.5 g（40 ~ 60 mmol）；②在体内缺钾引起严重快速室性异位心律失常时，钾盐浓度可升高至 0.5% ~ 1%，滴速可达每小时 1.5 g（每小时 20 mmol），补钾总量可达一日 10 g 或以上；③如病情危急，补钾浓度和速度可超过上述规定。但需严密动态观察血钾及心电图等，防止高钾血症发生。儿童剂量，一日按体重 0.22 g/kg（3.0 mmol/kg）或按体表面积 3.0 g/m² 计算。(2) 口服：钾盐用于治疗轻型低钾血症或预防性用药。①成人：一次 0.5 ~ 1 g（6.7 ~ 13.4 mmol），一日 2 ~ 4 次，餐后服用，一日最大剂量为 6 g（80 mmol）。氯化钾缓释片不要嚼碎应吞服。对口服片剂出现胃肠道反应者宜用溶液，稀释于冷开水或饮料中，分次服用；②儿童宜用溶液，一日 1 ~ 3 g/m²（15 ~ 40 mmol/m²）或 0.075 ~ 0.22 g/kg（1 ~ 3 mmol/kg），稀释于冷开水或饮料中，分次服用。

【制剂与规格】氯化钾片：① 0.25 g；② 0.5 g。

氯化钾缓释片：0.5 g。

氯化钾颗粒：1.6 g（相当于钾 0.524 g）。

氯化钾口服溶液：100 ml : 10 mg。

氯化钾注射液：① 10 ml : 1 g；② 10 ml : 1.5 g。

枸橼酸钾 [保（乙）]

Potassium Citrate

【适应证】用于防治各种原因造成的低钾血症。防治泌尿系结石。

【注意事项】(1) 用药期间注意复查

血钾浓度。排尿量低于正常水平的患者慎用。(2) 餐后服用以避免本品盐类缓泻作用。(3) 服用本品时应当用适量液体冲服，防止摄入高浓度钾盐制剂而产生对胃肠道损伤的作用。

【禁忌证】伴有少尿或氮质血症的严重肾功能损害患者、未经治疗的阿狄森病、急性脱水、中暑性痉挛、无尿、严重心肌损害、家族性周期性麻痹和各种原因引起的高钾血症患者。

【不良反应】口服可有异味感及胃肠道刺激症状。应用过量或原有肾功能损害时易发生高钾血症。

【用法与用量】口服：口服液一次10～20 ml，一日3次或遵医嘱。颗粒剂（剂量以枸橼酸钾为准）温开水冲服，一次1～2袋，一日3次或遵医嘱。

【制剂与规格】枸橼酸钾颗粒剂：2 g（含1.45 g枸橼酸钾）。

枸橼酸钾口服液：① 100 ml ∶ 10 g；② 200 ml ∶ 20 g。

门冬氨酸钾镁[保(乙)]

Potassium Aspartate and Magnesium Aspartate

【适应证】用于治疗和预防低钾血症，低钾及洋地黄中毒引起的心律失常，心肌炎后遗症，慢性心功能不全，急、慢性肝炎的辅助治疗。

【注意事项】(1) 不宜与保钾利尿药合用。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(3) 儿童用药：无可靠数据表明本品对儿童有任何毒害作用。(4) 老年用药：老年人肾脏清除能力下降，应慎用。

【禁忌证】高血钾、高血镁、严重肾功能障碍及三度房室传导阻滞患者禁用，心源性休克（血压低于90 mmHg）禁用。

【不良反应】滴注速度太快可引起高钾血症和高镁血症，还可出现恶心、呕吐、面部潮红、胸闷、血压下降，偶见血管刺激性疼痛。极少数可出现心率减慢，减慢滴速或停药后即可恢复。大剂量应用可能引起腹泻。

【用法与用量】(1) 口服：一次1～2片或一次1支口服液，一日3次。(2) 静脉滴注：一次10～20 ml，一日1次加入5%葡萄糖注射液250 ml或500 ml中缓慢滴注，或遵医嘱。

【制剂与规格】门冬氨酸钾镁片剂：每片含钾36 mg、镁11.8 mg。

门冬氨酸钾镁口服液：① 10 ml ∶ 钾103 mg、镁34 mg；② 5 ml ∶ 钾103 mg、镁34 mg。

门冬氨酸钾镁注射液：① 10 ml ∶ 钾114 mg、镁42 mg；② 20 ml ∶ 钾228 mg、镁82 mg。

口服补液盐[基(基)，保(甲)]

Oral Rehydration Salts

【适应证】用于防治腹泻、呕吐、经皮肤和呼吸道等液体丢失引起的轻、中度失水，可补充水、钾和钠。

【注意事项】(1) 各种水肿性疾病、忌钠盐性疾病、高钾血症、高血糖症患者慎用。(2) 腹泻停止后即停服。(3) 严重脱水时应用静脉输液法。(4) 应注意随访检查：血压、体重、血电解质（主要为Na^+和K^+）、失水体征、粪便量。(5) 妊娠期妇女及哺乳期用药资料尚不明确。(6) 老年人应用无特殊注意事项。(7) 儿童用药：一般不用于早产儿；婴幼儿应用本品时需少量多次给予，并在口服补液盐应用间期予以哺乳或日常喂养。(8) 当剂量超过一日100 ml/kg时，需给予饮水，以免发生高钠血症。

【禁忌证】少尿或无尿；严重失水、有休克征象；严重腹泻，粪便量超过每小时30 ml/kg；葡萄糖吸收障碍；由于严重呕吐等原因不能口服者；肠梗阻、肠麻痹和肠穿孔。

【不良反应】常见恶心、呕吐、咽部不适、胸痛等、高钠血症、水钠潴留。

【用法与用量】口服：将每包散剂溶于1 000 ml的凉开水中，搅匀，充分溶解后口服。(1) 成人轻至中度失水：一次500 ml，酌情调整剂量；或按50 ml/kg计算总量，分次于4～6小时服完；总量一日不得超过3 000 ml。其余应予静脉补液。(2) 儿童轻度失水：开始时50 ml/kg，4小时内服用，直至腹泻停止；或按一日每千克体重口服50～160 ml，分次于6小时内服完。

【制剂与规格】口服补液盐Ⅰ：每包14.75 g（大袋氯化钠1.75 g，葡萄糖11 g；小袋氯化钾0.75 g，碳酸氢钠1.25 g）。

口服补液盐Ⅱ：每包13.95 g（氯化钠1.75 g，葡萄糖10 g，枸橼酸钠1.45 g，氯化钾0.75 g）。

复方（糖）电解质注射液

【适应证】应用复方（糖）电解质输液的主要目的是调节体液平衡，同时补充部分的电解质及能量。输液总量的计算应根据“（生理维持量＋既往丢失量＋预计丢失量）× 安全系数”全面考虑；应根据不同的需要选择处方合理的产品。复方（糖）电解质输液采用工业化生产，使用方便快捷，减少临床配制可能造成的污染及输液差错的发生。此外，近年国内上市了含复合糖（包括葡萄糖、果糖、木糖等）和用醋酸代替乳酸的复方电解质注射液和复方糖电解质输液，对某些临床情况有其适应证。

【注意事项】(1) 高钾血症、少尿、阿狄森病、严重烧伤、氮质血症患者及糖尿病患者应慎用。(2) 最好在患者的尿量为一日500 ml或每小时20 ml以上时使用。(3) 用药时根据临床需要可做下列检查及观察：血气分析或血二氧化碳结合力检查；血清Na^+、K^+、Ca^{2+}、Cl^-浓度测定；肾功能测定，包括血尿素氮、肌酐等；血压；心肺功能状态，如水肿、气急、发绀、肺部啰音、颈静脉充盈、肝－颈静脉回流征等，按需做静脉压或中心静脉压测定。(4) 有妊娠高血压综合征者应注意避免水钠潴留。(5) 儿童及老年患者补液量和速度应严格控制（表11-1）。

【禁忌证】乳酸血症患者禁用乳酸盐。

【不良反应】快速大量给药时，可能出现水肿、血压升高、心率加快、胸闷、呼吸困难、甚至急性左侧心力衰竭。静脉滴注浓度较高，速度较快或静脉较细时，易刺激静脉内膜引起疼痛。滴注速度较快或原有肾功能损害时，应注意发生高钾血症。

【用法与用量】静脉滴注：按年龄、体重及症状可适当增减，成人用量一次500～1 000 ml，每小时不超过500 ml；儿童每小时50～100 ml。

【制剂与规格】复方（糖）电解质注射液：① 250 ml；② 500 ml。

混合糖电解质注射液

Carbohydrate and Electrolyte Injection

【适应证】本品含葡萄糖、果糖和木糖醇等3种糖类，适应于糖尿病、手术后或糖耐量异常患者补充部分能量、水电解质。其余同复方（糖）电解质注射液。

【注意事项】除葡萄糖外，本品含3%的果糖和1.5%木糖醇，过快静脉注射可能导致酸中毒。其余同复方（糖）电解质注射液。

【禁忌证】遗传性果糖不耐受者和对本品任一成分过敏者禁用。其余同复方（糖）电解质注射液。

【不良反应】其余同复方（糖）电解质注射液。

【用法与用量】缓慢静脉滴注：成人一日用量在500～1 000 ml，给药速率（以葡萄糖计算）每小时不超过0.5 g/kg。特殊年龄或疾病请遵医嘱。

【制剂与规格】混合糖电解质注射液：500 ml。本品为复方制剂，每瓶500 ml含葡萄糖30 g、果糖15 g、木糖醇7.5 g、氯化钠0.730 g、醋酸钠0.410 g、氯化钙0.185 g、氯化镁0.255 g、磷酸氢二钾0.870 g、硫酸锌0.700 g。

11.3.2 酸碱平衡调节药

碳酸氢钠[基(基)，保(甲)]

Sodium Bicarbonate

【适应证】用于代谢性酸中毒，碱化尿液以预防尿酸性肾结石，减少磺胺药的肾毒性，及急性溶血时防止血红蛋白沉积在肾小管，治疗胃酸过多引起的症状；静脉滴注对巴比妥类、水杨酸类药物及甲醇等药物中毒有非特异性的治疗作用。

【注意事项】(1) 对胃酸分泌试验或血、尿pH测定结果有明显影响。(2) 下列情况慎用：少尿或无尿；钠潴留并有水肿时；原发性高血压。(3) 下列情况不做静脉内用药：碱中毒；各种原因导致的大量胃液丢失；低钙血症时。(4) 长期或大量应用

表 11-1　复方电解质注射液

名称	用途	电解质浓度（mmol/L）							糖分含量(g/L)	渗透浓度(mOsm/L)
		Na^+	K^+	Ca^{2+}	Mg^{2+}	Cl^-	HCO_3^-	乳酸盐$^-$		
葡萄糖氯化钠注射液	主要用于细胞外液缺乏时的电解质及水分补充；含糖液体也补充部分热量（目前以醋酸钠林格最接近细胞外液成分）	154				154			50	
复方氯化钠（林格）注射液		146	4	2.5		155				307.5
醋酸钠林格注射液（复方电解质注射液）		140	5		3	98	27	23		294
乳酸钠林格注射液		130	4	1.5		109		28		272.5
复方乳酸钠葡萄糖注射液		130	4	1.5		109		28	50	551
复方乳酸钠山梨醇注射液		130	4	1.5		109		28	50	551
复方电解质葡萄糖注射液 M3A	用于经口摄取不足时的热量、水分和电解质补充（葡萄糖氯化钠钾多用于儿童）	60	10			50		20	27	
复方电解质葡萄糖注射液 M3B		50	20			50		20	27	
复方电解质葡萄糖注射液 MG3		50	20			50		20	100	
葡萄糖氯化钠钾		30	20			50			80	
复方电解质葡萄糖注射液 R2A	用于脱水(可以补充细胞内液)	60	25		1	49		25	23.5	297
复方电解质葡萄糖注射液 R4A	用于术后早期及婴幼儿水分、电解质补充	30				20		10	40	282

可致代谢性碱中毒，并且钠负荷过高引起水肿等，妊娠期妇女应慎用。本品可经乳汁分泌，但对婴儿的影响尚无有关资料。

【禁忌证】禁用于吞食强酸中毒时的洗胃。

【不良反应】大量注射、存在肾功能不全或长期应用时可出现心律失常、肌肉痉挛、疼痛、异常疲倦虚弱、呼吸减慢、口内异味、尿频、尿急、持续性头痛、食欲减退、恶心呕吐等。

【用法与用量】口服：(1) 成人，①用于制酸，一次 0.5 ~ 1.0 g，一日 3 次，餐前服用；②碱化尿液：口服，首次 4 g，以后每 4 小时 1 ~ 2 g。静脉滴注，2 ~ 5 mmol/kg，4 ~ 8 小时滴注完毕；③代谢性酸中毒：口服，一次 0.5 ~ 2 g，一日 3 次。静脉滴注，所需剂量按下式计算：补碱量 (mmol) = (−2.3− 实际测得的 BE 值) ×0.25× 体重 (kg)，或补碱量 (mmol) = [正常的 CO_2CP − 实际测得的 CO_2CP (mmol)]×0.25× 体重 (kg)。一般先给计算剂量的 1/3 ~ 1/2，4 ~ 8 小时滴注完毕。心肺复苏抢救时，因存在致命的酸中毒，应快速静脉输注，首次 1 mmol/kg，以后根据血气分析结果调整用量。(每 1g 碳酸氢钠相当于 12 mmol 碳酸氢根)。(2) 儿童，①用于制酸，6 岁以下儿童尚无统一标准剂量。6 ~ 12 岁者一次 0.5 g，0.5 小时可重复一次；②碱化尿液：口服，一日按体重 1 ~ 10 mmol/kg；③代谢性酸中毒：参考成人剂量。心肺复苏抢救时，首次静脉输注按体重 1 mmol/kg，以后根据血气分析结果调整剂量。

【制剂与规格】碳酸氢钠片：0.3 g；0.5 g。

碳酸氢钠注射液：① 10 ml : 0.5 g；② 100 ml : 5 g；③ 250 ml : 11.5 g。

乳酸钠 [保 (甲)]

Sodium Lactate

【适应证】(1) 适用于纠正代谢性酸中毒。(2) 用作腹膜透析液中的缓冲剂。(3) 用于伴严重心律失常、QRS 波增宽的高钾血症。(4) 用于碱化尿液，预防和治疗尿酸结石、婴儿肠炎等。

【注意事项】(1) 以下情况慎用：①水肿患者伴有钠潴留倾向时；②轻中度肾功能不全者；③高血压患者 (包括妊娠高血压综合征)；④心功能不全者；⑤肝功能不全者；⑥缺氧及休克患者；⑦老年患者；⑧脚气病患者；⑨酗酒、水杨酸中毒或 I 型糖原沉积病患者；⑩服用双胍类药物 (尤其是苯乙双胍) 治疗糖尿病者或糖尿病酮症酸中毒患者。(2) 用药前后及用药时应当检查或监测：①血气分析或二氧化碳结合力；②血清钠、钾、钙、氯浓度；③肾功能，包括血肌酸酐、尿素氮等；④血压；⑤心肺功能，必要时测定静脉压或中心静脉压；⑥肝功能。

【禁忌证】(1) 心力衰竭及急性肺水肿。(2) 脑水肿。(3) 严重乳酸性酸中毒。(4) 严重肝功能不全。(5) 严重肾衰竭 (少尿或无尿时)。

【不良反应】(1) 低血钙者应用本药纠正酸中毒后，常出现手足发麻、疼痛、搐搦、呼吸困难等症状。(2) 可出现心力衰竭、肺水肿的表现，如心率加速、胸闷、气急等。(3) 血压升高。(4) 体重增加、水肿。(5) 可出现低钾血症。(6) 焦虑、惊恐、出汗、感觉异常、震颤、眩晕等反应。

【用法与用量】静脉滴注：(1) 代谢性酸中毒：应根据患者碱缺失情况计算给药量，所需乳酸钠 (mol/L) 的体积 (ml) = 碱缺失 (mmol/L)×0.3× 体重 (kg)。目前已不常采用本药纠正代谢性酸中毒。(2) 高钾血症：首次可静脉滴注本药 11.2% 注射液 40 ~ 60 ml，以后酌情给药。严重高钾血症患者应于心电图监护下给药，有时用量需高达 200 ml 方可显效，应注意监测，以防出现血钠过高及心力衰竭。

【制剂与规格】乳酸钠注射液：① 10 ml : 1.12 g；② 20 ml : 2.24 g；③ 50 ml : 5.6 g。

复合磷酸氢钾 [保 (乙)]

Compound Potassium Dihydrogen Phosphate

【适应证】用于完全胃肠外营养疗法中作为磷的补充剂，如中等以上手术或其他创伤需禁食 5 日以上的病人的磷的补充

剂。本品亦可用于某些疾病所致低磷血症。

【注意事项】(1) 本品严禁直接注射，必须稀释200倍以上，方可经静脉滴注，并须注意控制滴注速度。(2) 本品仅限于不能进食的病人使用。(3) 肾衰竭患者不宜应用。(4) 本品与含钙注射液配伍时易析出沉淀，不宜混合使用。(5) 如过量使用本品可出现高磷血症、低钙血症、肌肉颤搐、痉挛、胃肠道不适等，出现中毒症状，应立即停药。

【不良反应】(1) 高钾血症，表现为心律失常、口唇麻木或刺痛、四肢乏力等。(2) 可出现高磷血症，并诱发低钙血症。表现为手足麻木、搐搦、肌痉挛、呼吸困难等。

【用法与用量】将本品稀释200倍以上，供静脉滴注。一般在完全胃肠外营养疗法中，每千卡热量加入本品2.5 ml（相当$[PO_4]^{3-}$ 8 mmol），并控制滴注速度。

【制剂与规格】复合磷酸氢钾注射液：2 ml（每毫升含磷酸氢二钾三水结晶物319.5 mg、磷酸二氢钾217.7 mg）。

大黄碳酸氢钠片：每片含大黄0.15 g、碳酸氢钠0.15 g、薄荷油。用于食欲缺乏、胃酸过多。口服：一次1~3片，一日3次。

11.4 维生素类

维生素是一类维持人体正常代谢和健康所必需的小分子有机化合物。大部分维生素在人体内不能合成或合成量不足而必须从食物中摄取。正常情况下可由饮食摄入满足需要。维生素摄入不足可引起维生素缺乏症，如维生素B_1缺乏可引起脚气病等。维生素包括水溶性和脂溶性两大类，前者有维生素B_1、维生素B_2、维生素B_6、维生素B_{12}、烟酸、烟酰胺、维生素C、叶酸等，后者有维生素A、维生素D、维生素E、维生素K等，补充过量极易蓄积中毒。临床患者维生素缺乏的常见原因有不能进食或进食不足，消化吸收障碍、分解代谢增强、生理需要量增加、不合理的肠外营养支持以及肠道菌群失调等。左卡尼汀是脂肪进入细胞的线粒体氧化的载体，是辅酶中的一员，暂时归入维生素大类。

维生素A [保(乙)]

Vitamin A

【适应证】用于防治维生素A缺乏症，如角膜软化、眼干燥症、夜盲症、皮肤角质粗糙等。

【注意事项】(1) 慢性肾功能减退时慎用。(2)妊娠期对维生素A需要量较多，但一日不宜超过6 000 U。(3) 婴幼儿对大量维生素A较敏感，应慎用。(4) 大量或长期服用维生素A可能引起齿龈出血，唇干裂。(5) 老年人长期服用维生素A可能因视黄醛廓清延迟而致维生素A过量。(6) 长期服用，应随访监测：暗适应试验，眼震颤，血浆胡萝卜素及维生素A含量测定。

【禁忌证】维生素A过多症患者禁用。

【不良反应】过量可引起慢性中毒。急性中毒可见异常激动、嗜睡、复视、颅内压增高等症状。

【用法与用量】成人：(1) 口服：①用于预防，一日5 000 U。②用于严重维生素缺乏的治疗，成人一日10万U，3日后改为一日5万U，给药2周后一日1万~2万U，再用2个月；③用于轻度维生素缺乏的治疗，一日3万~5万U，分2~3次服用后，症状改善后减量；④用于眼干燥症，成人一日2.5万~5万U，服用1~2周。(2)肌内注射：一日6万~10万U，连续3日，以后一日5万U，共用2周。儿童：(1) 口服：①用于预防，0~1岁儿童一日600~1 500 U，2~3岁儿童一日2 000 U，4~6岁一日2 500 U，7~10岁一日3 500 U；②用于治疗，一日5 000 U。(2) 肌内注射：用于维生素A缺乏，一日2.5万~5万U，连续给药至症状及体征好转；有恶心、呕吐、吸收不良综合征、眼损害较严重或于手术前后时，>1岁儿童一日0.5万~1万U，共10日，>8岁以上儿童剂量同成人。

【制剂与规格】维生素A胶囊：①2 500 U；②5 000 U。

维生素A注射液：①0.5 ml：25 000 U；②1 ml：25 000 U。

水溶性维生素A注射液：1 ml：50 000 U。

维生素 E

Vitamin E

【适应证】母亲所生新生儿、早产儿、低出生体重儿吸收不良。进行性肌营养不良，以及心、脑血管疾病、习惯性流产及不孕症的辅助治疗。

【注意事项】大量可致血清胆固醇及血清三酰甘油升高。对维生素 K 缺乏而引起的低凝血酶原血症及缺铁性贫血患者谨慎。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】大量长期应用可引起：血栓形成、视物模糊、乳房肿大、腹泻、头晕、流感样综合征、头痛、恶心及胃痉挛、乏力软弱。

【用法与用量】维生素 E 缺乏，治疗量随缺乏程度而异。常用口服量：成人，一次 10 ~ 100 mg，一日 2 ~ 3 次；儿童，一日 1 mg/kg，早产儿一日 15 ~ 20 mg。

【制剂与规格】维生素 E 胶丸：①10 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

维生素 E 注射液：①1 ml : 5 mg；②1 ml : 50 mg。

维生素 K_1 用于维生素 K 依赖性凝血因子过低导致的凝血障碍；中度梗阻性黄疸等伴有凝血功能改变。肌内注射，一次 10 mg，一日 1 ~ 2 次，24 小时内总量不超过 40 mg。(其他见 6.4)

维生素 C [基(基), 保(甲/乙)]

Vitamin C

【适应证】预防和治疗坏血病，创伤愈合期，急慢性传染病，紫癜及过敏性疾病的辅助治疗；特发性高铁血红蛋白血症的治疗；慢性铁中毒的治疗；克山病患者发生心源性休克时，可用大剂量本品治疗；某些病对维生素 C 需要量增加，如：接受慢性血液透析的患者、发热、创伤、感染、手术后的患者，严格控制饮食、营养不良。

【注意事项】(1) 突然停药可能出现坏血病症状。(2) 下列情况慎用，如半胱氨酸尿症，痛风，高草酸盐尿症，尿酸盐性肾结石，糖尿病，葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏症。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。肝性脑病时禁用。

【不良反应】可见腹泻、皮肤潮红、头痛、尿频、恶心呕吐、胃部不适等反应。大量可能引起尿酸盐、半胱氨酸或草酸盐结石。

【用法与用量】(1) 口服：一般治疗维生素 C 缺乏症，成人一次 0.1 ~ 0.2 g，一日 2 ~ 3 次。儿童一日 100 ~ 300 mg，分 2 ~ 3 次服。(2) 静脉注射或肌内注射，一日 0.25 ~ 0.5 g，至少 2 周。儿童一日 100 ~ 300 mg，至少 2 周。

【制剂与规格】维生素 C 片：①25 mg；② 50 mg；③ 100 mg。

维生素 C 注射液：① 2 ml : 0.1 g；② 2 ml : 0.25 g；③ 5 ml : 0.5 g；④ 20 ml : 2.5 g。

维生素 B_1 [基(基), 保(甲/乙)]

Vitamin B_1

【适应证】用于维生素 B_1 缺乏所致的脚气病或威克尔脑病的治疗，亦可用于维生素 B_1 缺乏引起的周围神经炎、消化不良等的辅助治疗。

【注意事项】大剂量应用时，测定尿酸浓度可呈假性增高，尿胆原可呈假阳性。偶见过敏反应，个别可发生过敏性休克，应在注射前用其 10 倍稀释后 0.1 ml 做皮试，以防过敏反应，不宜静脉注射。

【禁忌证】对本品过敏者忌用。

【不良反应】过量可出现头痛、疲倦、烦躁、食欲减退、腹泻、水肿，偶见过敏反应。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 5 ~ 10 mg，一日 3 次；儿童一日 10 mg。(2) 肌内注射：用于重型脚气病，成人一次 50 ~ 100 mg，一日 3 次，症状改善后口服；儿童，一日 10 ~ 25 mg，症状改善后口服。

【制剂与规格】维生素 B_1 片：① 5 mg；② 10 mg。

维生素 B_1 注射液(仅用于肌内注射)：① 2 ml : 50 mg；② 2 ml : 100 mg。

维生素 B_2 [基(基), 保(甲/乙)]

Vitamin B_2

【适应证】用于防治维生素 B_2 缺乏症，

如口角炎、唇干裂、舌炎、阴囊炎、角膜血管化、结膜炎、脂溢性皮炎等。

【注意事项】(1) 当药品性状发生改变时禁止服用。(2) 饭后口服吸收较完整。(3) 不宜与甲氧氯普胺合用。

【禁忌证】对本品过敏者忌用。

【不良反应】在正常肾功能状态下几乎不产生毒性；大量服用后尿呈黄色。

【用法与用量】(1) 口服：成人一次 5 ~ 10 mg，一日 3 次。儿童（12 岁及 12 岁以下）：一日 3 ~ 10 mg，分 2 ~ 3 次服。(2) 肌内注射：成人一次 5 ~ 10 mg，一日 1 次。儿童一次 2.5 ~ 5 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】维生素 B_2 片：① 5 mg；② 10 mg。

维生素 B_2 注射液：① 2 ml : 1 mg；② 2 ml : 5 mg；③ 2 ml : 10 mg。

维生素 B_6 [基(基)、保(甲/乙)]

Vitamin B_6

【适应证】用于维生素 B_6 缺乏的预防和治疗，防治异烟肼中毒、脂溢性皮炎、口唇干裂，也可用于妊娠及放化疗抗癌所致的呕吐，新生儿遗传性维生素 B_6 依赖综合征。

【注意事项】(1) 老人、孕妇及哺乳期妇女应在医师指导下使用本品。(2) 本品可使尿胆原试验呈假阳性。

【禁忌证】对本品过敏者忌用。

【不良反应】长期大量可引起严重神经感觉异常，进行性步态不稳至足麻木、手不灵活。

【用法与用量】(1) 口服：用于维生素 B_6 缺乏症，成人一日 10 ~ 20 mg，连续 3 周，以后每日 2 ~ 3 mg，持续数周。儿童一日 2.5 ~ 10 mg，连续 3 周，以后每日 2 ~ 5 mg，持续数周。(2) 皮下注射或肌内注射一次 50 ~ 100 mg，一日 1 次。(3) 异烟肼中毒解毒：每异烟肼 1 g 同时应用维生素 B_6 1 g 静脉注射。

【制剂与规格】维生素 B_6 片：10 mg。

维生素 B_6 注射剂：① 1 ml : 25 mg；② 1 ml : 50 mg；③ 2 ml : 100 mg。

烟酸 [保(乙)] 预防和治疗烟酸缺乏症，如糙皮病；也用作血管扩张，治疗高脂血症。(1) 糙皮病：成人口服，一次 50 ~ 100 mg，一日 3 次，餐后服，一日可用到 500 mg；静脉注射，一次 25 ~ 100 mg，一日 2 次或 50 ~ 200 mg 加入 5% ~ 10% 葡萄糖液 100 ~ 200 ml 中静脉滴注，一日 1 次。小儿，口服，一次 25 ~ 50 mg，一日 3 次；静脉缓慢注射：一日 300 mg。(2) 调节血脂：开始口服 50 ~ 100 mg，一日 3 次，1 ~ 3 周后可增至一日 2 ~ 3 g。(其他见 4.5.3.3)

烟酰胺 [保(乙)]

Nicotinamide

【适应证】冠心病、病毒性心肌炎、风湿性心肌炎及少数洋地黄中毒等伴发的心律失常。

【注意事项】烟酰胺无扩张血管作用，高血压患者需要时可用。妊娠期服用过量有致畸的可能。哺乳期妇女使用本品时不宜哺乳。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】给药后可出现皮肤潮红和瘙痒等；偶尔可发生高血糖、高尿酸血症；个别有头晕、恶心、食欲缺乏等。

【用法与用量】静脉滴注：一次 300 ~ 400 mg，一日 1 次。加入 10% 葡萄糖注射液 250 ml 静脉滴注。30 日为 1 个疗程。

【制剂与规格】烟酰胺注射液：① 1 ml : 500 mg；② 1 ml : 100 mg。

复合维生素 B [保(乙)]

Complex Vitamin B

【适应证】用于预防和治疗 B 族维生素缺乏所致的营养不良、厌食、脚气病、糙皮病等。

【注意事项】(1) 当药物性状发生改变时禁止服用。(2) 日常补充和预防时，宜用最低量。

【禁忌证】对本品过敏者忌用。

【不良反应】大剂量服用可出现烦躁、疲倦、食欲减退等。偶见皮肤潮红、瘙痒。尿液可能呈黄色。

【用法与用量】口服：成人一次 1 ~ 3 片，一日 3 次。儿童一次 1 ~ 2 片，一日 3 次。

【制剂与规格】复合维生素 B 片：每片含维生素 B_1 3 mg、维生素 B_2 1.5 mg、维生素 B_6 0.2 mg、烟酰胺 10 mg，泛酸钙 1 mg。

维生素 AD

Vitamin AD

【适应证】用于预防和治疗维生素 A 及 D 缺乏症，如夜盲症、干燥性眼炎、佝偻病、软骨症等。

【注意事项】高钙血症妊娠期妇女可伴有维生素 D 敏感，功能上又能抑制甲状旁腺活动，以致婴儿有特殊面容、智力低下及患遗传性主动脉弓缩窄。老年人长期服用本品，可能因视黄醛清除延迟而致维生素 A 过量。过敏体质者慎用。

【禁忌证】肾衰竭、高钙血症、高磷血症伴肾性佝偻病者禁用。

【不良反应】可见骨关节疼痛、肿胀、皮肤瘙痒、口唇干裂、发热、头痛、呕吐、便秘、腹泻、恶心等。

【用法与用量】(1) 口服：1 岁以上儿童，一次 1 丸，一日 1 次。(2) 肌内注射：儿童一次 0.5 ~ 1 ml，一日 1 次。

【制剂与规格】维生素 AD 胶丸：①维生素 A 3 000 U（或 5 000 U）；②维生素 D 300 U（或 500 U）。

维生素 AD 注射剂：① 0.5 ml ∶ 维生素A 2.5 万 U；②维生素D 2 500 U。

维生素 AD 滴剂：①每 1 ml 含维生素 A 50 000 U；②维生素 D 5 000 U。

左卡尼汀[保(乙)]

Levocarnitine

脂肪进入细胞的线粒体氧化的载体，是辅酶中的一员，暂时归入维生素类。

【适应证】预防和治疗左卡尼汀缺乏症。依赖血液透析的慢性肾衰竭患者，可以改善骨骼肌病、心律失常、高脂血症、低血压和透析中肌痉挛等症状。

【注意事项】(1) 用胰岛素或其他降糖药物的患者可能有低血糖的发生，应检测患者的血糖在控制数值以内。(2)含有少量乙醇，对乙醇过敏的患者慎用。(3) 静脉注射剂常稀释后由静脉滴注。(4) 肾功能不全者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见口干、胃肠轻度不适，停药后可自行消失。

【用法与用量】口服：成人一日 1 ~ 3 g，分 2 ~ 3 次服用。儿童按体重 50 mg/kg 开始使用，依据需要和耐受性缓慢增加剂量。用餐时服用。

【制剂与规格】左卡尼汀口服液：10 ml ∶ 1 g。

注射用水溶性维生素

Water-soluble Vitamin for Injection

【适应证】肠外营养的组成部分之一，用以满足成人和儿童每日对水溶性维生素的生理需要。

【注意事项】本品加入葡萄糖注射液中进行输注时，应注意避免某些高敏患者可发生过敏反应。

【禁忌证】对本品中任一成分有过敏的患者禁用。

【不良反应】可能发生过敏反应。

【用法与用量】静脉滴注：成人和体重 10 kg 以上儿童，一日 1 瓶；新生儿及体重不满 10 kg 的儿童，按每千克体重一日 1/10 瓶。

【制剂与规格】注射用水溶性维生素：每瓶含硝酸硫胺 3.1 mg、核黄素磷酸钠 4.9 mg、烟酰胺 40 mg、盐酸吡哆辛 4.9 mg、泛酸钠 16.5 mg、维生素 C 钠 113 mg、生物素 60 μg、叶酸 0.4 mg、维生素 B_{12} 5 μg、甘氨酸 300 mg、乙二胺四乙酸二钠 0.5 mg、对羟基苯甲酸甲酯 0.5 mg。

脂溶性维生素注射液（Ⅰ）

Fat-soluble Vitamin Injection (Ⅰ)

【适应证】肠外营养的组成部分之一。满足儿童一日对脂溶性维生素 A、维生素 D_2、维生素 E、维生素 K_1 的生理需要。

【注意事项】(1) 本品在冷处（2 ~ 10℃）避光保存。(2) 必须稀释后静脉滴注。用前 1 小时配制，24 小时内用完。(3) 不宜与香豆素类抗凝血药等合用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】未见明显不良反应报告。

【用法与用量】适用于 11 岁以下儿童

及婴儿，按体重一日 1 ml/kg，一日最大剂量 10 ml。使用前在无菌条件下，将本品加入到脂肪乳注射液内（100 ml 或以上量），轻轻摇匀后输注，并在 24 小时内用完。

【制剂与规格】脂溶性维生素注射液（Ⅰ）每 10 ml 所含组分为：维生素 A 0.69 mg；维生素 D_2 10 μg；维生素 E 6.4 mg；维生素 K_1 0.20 mg。

脂溶性维生素注射液（Ⅱ）

Fat-soluble Vitamin Injection (Ⅱ)

【适应证】肠外营养不可少组成部分之一，用以满足成人每日对脂溶性维生素 A、维生素 D、维生素 E、维生素 K 的生理性需要。

【注意事项】(1) 本品冷处（2 ~ 10℃）避光保存。(2) 必须稀释后静脉滴注。用前 1 小时配制，24 小时内用完。(3) 不宜与香豆素类抗凝药等合用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见体温上升和寒战；可能出现血清门冬氨酸氨基转移酶、碱性磷酸酶和胆红素升高，减量或暂停药即可恢复正常。

【用法与用量】静脉滴注：成人和 11 岁以上儿童，一日 10 ml（1 安瓿）。使用前在无菌条件下，将本品加入到脂肪乳注射液 500 ml 内，摇匀后即输注，并在 24 小时内用完。

【制剂与规格】脂溶性维生素注射液（Ⅱ）每 10 ml 所含组分为：维生素 A 0.99 mg；维生素 D_2 5 μg；维生素 E 9.1 mg；维生素 K_1 0.15 mg。

注射用多种维生素（12）

Multivitamin for Injection (12)

【适应证】肠外营养中需要维生素补充的患者，可同时补充水溶性和脂溶性维生素。

【注意事项】必须稀释后静脉滴注。用前 1 小时配制，24 小时内用完。

【禁忌证】已知对本品任一活性成分过敏者，尤其是对维生素 B_1 或辅料过敏者；已存在的维生素过多症；新生儿，婴儿及 11 岁以下的儿童。

【不良反应】 可能发生过敏反应。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：成人和 11 岁以上儿童，一日 10 ml（1 安瓿）。对营养需求增加的病例（如严重烧伤），也可按一日给药量的 2 ~ 3 倍给药。输注前即刻用 5 ml 注射用水溶解瓶内内容物。(2) 肌内注射：注射前即刻用 2.5 ml 注射用水溶解瓶内内容物。(3) 复溶方法：用注射器吸取 5 ml 注射用水、5%葡萄糖注射液或 0.9%氯化钠注射液加入到瓶内。轻轻混合并溶解粉末。得到橘黄色溶液。复溶后，通过静脉缓慢注射（至少 10 分钟）或者以 5% 葡萄糖溶液或 0.9%氯化钠溶液进行输注。

【制剂与规格】注射用多种维生素：每支含维生素 A 3 500 U、维生素 D_3 220 U、维生素 E 10.2 mg、维生素 C 125 mg、维生素 B_2 5.67 mg、四水脱羧辅酶 5.8 mg、维生素 B_6 5.5 mg、维生素 B_{12} 6 μg、叶酸 414 μg、右旋泛醇 16.15 mg、生物素 69 μg、烟酰胺 46 mg。

11.5 矿物质类

矿物质具有特殊的营养价值及生理功能，缺乏时可引起疾病或影响正常生长发育。一般情况下不会出现摄入不足，但经口进食不足或不能进食者常出现摄入不足或缺乏，也常见于消化道功能异常、生理需要量增加例如妊娠期妇女、肠外营养时没有及时补充等情况。

氯化钙 治疗钙缺乏，急性血钙过低，碱中毒及甲状旁腺功能低下所致的手足搐搦症；维生素 D 缺乏症；镁中毒、氟中毒的解救；心脏复苏时应用，如高血钾、低血钙，或钙通道阻滞引起的心功能异常的解救等。稀释后缓慢静脉注射（每分钟不超过 0.5 ml，即 13.6 mg 钙），一次 0.5 ~ 1 g，根据病人情况，血钙浓度，1 ~ 3 日重复给药。用于低钙或电解质补充。儿童用量，25 mg/kg（6.8 mg 钙）。（其他见 5.5.2.1）

碳酸钙 用于预防和治疗钙缺乏症，如骨质疏松、骨发育不全、佝偻病等；妊娠、

哺乳期、绝经期妇女及老年人钙的补充。(1) 口服：用于高磷血症，一日 1.5～3 g，分次于进餐时服用。(2) 补钙：一日 0.5～2 g，分次于餐后服用。(其他见 5.5.2.1)

葡萄糖酸钙 用于治疗钙缺乏，急性血钙过低，碱中毒及甲状旁腺功能低下所致的手足搐搦症；镁中毒、氟中毒的解救；过敏性疾病等；用于心脏复苏时间（如高血钾、低血钙或钙通道阻滞引起的心功能异常的解救）。(1) 口服：一次 0.5～2 g，一日 3 次；儿童，一次 0.5～1 g，一日 2～3 次。(2) 静脉注射或静脉滴注：用 10% 葡萄糖注射液稀释后缓慢注射，每分钟不超过 5 ml。成人，①低钙血症，一次 1 g，需要时可重复；②高镁血症，一次 1～2 g；③氟中毒解救，静脉注射 1 g，1 小时后重复，如有搐搦，可静脉注射 3 g。(其他见 5.5.2.1)

甘油磷酸钠注射液 [保(乙)]

Sodium Glycerophosphate Injection

【适应证】成人静脉营养时的磷补充剂、磷缺乏患者、低磷血症。

【注意事项】肾功能障碍患者应慎用；不得直接静脉滴注，应稀释后于 24 小时内使用且注意控制给药速度。

【禁忌证】对本品过敏者，休克、脱水、严重肾功能不全者禁用。

【不良反应】长期用药可引起血磷升高、血钙降低。

【用法与用量】静脉滴注：一日 10 ml，2.16 g，对接受静脉治疗者应根据实际情况酌情增减。加入复方氨基酸注射液或 5% 或 10% 葡萄糖注射液 500 ml 中（注射用甘油磷酸钠应先用 10 ml 注射用水溶解），4～6 小时缓慢滴注，滴速每小时 1.7～2.5 mmol 或 360～540 mg。

【制剂与规格】甘油磷酸钠注射液：10 ml：2.16 g。

注射用甘油磷酸钠：2.16 g。

硫酸镁 [基(基)，保(甲)]

Magnesium Sulfate

【适应证】(1) 用于便秘、肠内异常发酵，亦可与驱虫剂并用；与活性炭合用，可治疗食物或药物中毒。(2) 用于阻塞性黄疸及慢性胆囊炎。(3) 用于惊厥、子痫、尿毒症、破伤风、高血压脑病及急性肾性高血压危象等。(4) 也用于发作频繁而其他治疗效果不好的心绞痛患者，对伴有高血压的患者效果较好。(5) 外用热敷，消炎去肿。(6) 用于治疗早产。

【注意事项】(1) 导泻时，如服用大量浓度过高的溶液，可能自组织中吸取大量水分而导致脱水。(2) 应用硫酸镁注射液前须查肾功能，如肾功能不全应慎用，用药量应减少；有心肌损害、心脏传导阻滞时应慎用或不用。(3) 每次用药前和用药过程中，定时做膝腱反射检查，测定呼吸次数、观察排尿量、血镁浓度。当血镁浓度致临床出现膝腱反射明显减弱或消失，或呼吸次数每分钟少于 14～16 次，每小时尿量少于 25～30 ml 或 24 小时少于 600 ml，应及时停药。(4) 用药过程中突然出现胸闷、胸痛、呼吸急促，应及时听诊，必要时胸部 X 线片，以便及早发现肺水肿。(5) 如出现急性镁中毒现象，可用钙剂静注解救，常用的为 10% 葡萄糖酸钙注射液 10 ml 缓慢注射。(6) 老年患者尤其年龄在 60 岁以上者慎用。(7) 保胎治疗时，不宜与肾上腺 β 受体激动药同时使用，否则容易引起血管的不良反应。

【禁忌证】肠道出血患者、急腹症患者及妊娠期妇女、经期妇女禁用本品导泻。

【不良反应】(1) 导泻时如浓度过高，可引起脱水；胃肠道有溃疡、破损之处，易造成镁离子大量的吸收而引起中毒。(2) 静脉注射硫酸镁常引起潮红、出汗、口干等症状，快速静脉注射时可引起恶心、呕吐、心慌、头晕，个别出现眼球震颤，减慢注射速度症状可消失。(3) 肾功能不全，用药剂量大，血镁浓度达 5 mmol/L 时，可出现肌肉兴奋性受抑制，感觉反应迟钝，膝腱反射消失，呼吸开始受抑制，血镁浓度达 6 mmol/L 时可发生呼吸停止和心律失常，心脏传导阻滞，浓度进一步升高，可使心搏停止。(4) 连续使用硫酸镁可引起便秘，部分患者可出现麻痹性肠梗阻，停药后好转。(5) 极少数血钙降低，再现低钙血症。(6) 镁离子可自由透过胎盘屏障，造成新生儿高镁血症，表现为肌

张力低，吸吮力差，不活跃，哭声不响亮等，少数有呼吸抑制现象。(7) 少数妊娠期妇女出现肺水肿。

【用法与用量】(1) 口服：①导泻，一次 5 ~ 20 g，一般为清晨空腹服，同时饮 100 ~ 400 ml 水，也可用水溶解后服用；②利胆，一次 2 ~ 5 g，一日 3 次，餐前或两餐间服。也可服用 33%溶液，一次 10 ml。(2) 肌内注射或静脉注射：①抗惊厥、子痫、降血压等 25%溶液，一次 4 ~ 10 ml；或将 25%溶液 10 ml 用 5% ~ 10%葡萄糖注射液稀释成 1%或 5%浓度后静脉滴注。②治疗儿童惊厥肌内注射或静脉用药：一次 0.1 ~ 0.15 g/kg，以 5% ~ 10%葡萄糖注射液将本品稀释成 1%溶液，静脉滴注或稀释成 5% 溶液，缓慢静脉注射。25% 溶液可做深层肌内注射。一般儿科仅用肌内注射或静脉用药，安全。③治心绞痛：可将 10%溶液 10 ml 用 5% ~ 10%葡萄糖注射液 10 ml 稀释后缓慢静脉注射，一日 1 次，连续 10 日。④治疗中重度妊娠高血压症、先兆子痫和子痫首次剂量为 2.5 ~ 4 g，用 25% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释后，5 分钟内缓慢静脉注射，以后每小时 1 ~ 2 g 静脉滴注维持。24 小时总量为 30 g，根据膝腱反射、呼吸次数和尿量监测。⑤治疗早产：首次负荷量为 4 g，用 25%葡萄糖注射液 20 ml 稀释后 5 分钟内缓慢静脉注射，以后用 25%硫酸镁注射液 60 ml 加入 5%葡萄糖注射液 1 000 ml 中静脉滴注，速度为每小时 2 g，直到宫缩停止后 2 小时，以后口服 β 肾上腺受体激动药维持。

【制剂与规格】硫酸镁注射液：① 10 ml : 1 g；② 10 ml : 2.5 g。

硫酸镁散剂：50 g。

硫酸锌 [保(乙)]

Zinc Sulfate

【适应证】用于锌缺乏引起的食欲缺乏、贫血、生长发育迟缓、营养性侏儒、男性性腺功能低下及肠病性肢端皮炎，也可用于异食癖、类风湿关节炎、间歇性跛行、肝豆状核变性（适用于不能用青霉胺者）、痤疮、慢性溃疡、结膜炎、口疮等的辅助治疗。

【注意事项】(1) 宜餐后服用，以减少胃肠道刺激。(2) 超量服用可出现中毒反应，表现如急性胃肠炎、恶心、呕吐、腹痛、腹泻。

【禁忌证】消化道溃疡患者禁用。

【不良反应】本品有胃肠道刺激性，可有轻度恶心、呕吐、便秘，服用 0.2 ~ 2 g 可催吐；偶见皮疹、胃肠道出血；罕见肠穿孔。

【用法与用量】口服：成人常用量，治疗量一日 300 mg（含锌 68 mg），分 3 次服，长期服用可根据血浆锌浓度不高于 30.6 μmol / L 进行剂量调整。

【制剂与规格】硫酸锌片：① 25 mg（含锌 5.7 mg）；② 50 mg（含锌 11.4 mg）。

葡萄糖酸锌

Zinc Gluconate

【适应证】各种缺锌性疾病。也有应用于缺锌导致的厌食症、缺锌导致的生长发育迟缓等。

【注意事项】(1) 不宜空腹服或过量服用。(2) 本品宜餐后服用以减少胃肠道刺激。(3) 应在确诊为缺锌症时使用，如需长期服用，必须在医师指导下使用。

【禁忌证】对锌制剂过敏的患者禁用本品。

【不良反应】个别有恶心、胃不适、便秘、腹痛、过敏性皮疹等。过量的锌进入体内可引起钙和铁缺乏，还可影响铜、铁离子的代谢。

【用法与用量】口服：用于儿童厌食症，一次 1 ~ 2 mg/kg，一日 2 次。皮肤痤疮，一次 25 mg，一日 2 次，3 周为 1 个疗程。

【制剂与规格】葡萄糖酸锌片：以锌含量计① 5 mg；② 11.5 mg。

葡萄糖酸锌胶囊：以锌含量计 25 mg。

葡萄糖酸锌颗粒：① 70 mg（相当于元素锌 10 mg）；② 100 mg（相当于元素锌 14.3 mg）。

葡萄糖酸锌口服液：100 ml : 35.3 mg。

葡萄糖酸锌糖浆剂：100 ml : 50 mg。

多种微量元素注射液

Multi-trace Elements Injection

【适应证】肠外营养的多种微量元素

的补充剂，10 ml 能满足成人每日对铬、铁、锰、钼、硒、锌、氟和碘的基本和中等需要。孕妇对微量元素的需要量轻度增高，故本品也适用于妊娠妇女。

【注意事项】(1) 微量元素代谢障碍和胆道功能明显减退，以及肾功能障碍者慎用。(2) 未稀释不能输注。(3) 本品经外周静脉输注时，每 500 ml 复方氨基酸注射液或葡萄糖注射液最多可以加入本品 10 ml。(4) 不可添加其他药物，以避免可能发生的沉淀。(5) 必须在静注前 1 小时内加入稀释液中，输注时间不超过 24 小时。(6) 输注速率不宜过快，按用法用量中推荐时间进行。(7) 长期使用中，注意监测各微量元素缺乏或过量的有关症候，进行相应的药物调整。

【禁忌证】肾功能严重障碍、不耐果糖患者禁用。

【不良反应】输注速度过快时可能造成患者心肾负担过重，使原有心肾功能障碍的患者病情加重。

【用法与用量】成人推荐剂量：一日 10 ml。在配伍得到保证的前提下用本品 10 ml 加入 500 ml 复方氨基酸或葡萄糖注射液中，配成营养液后，按规定在 16 ~ 24 小时输完，输注速率不宜过快。体重超过 15 kg 的儿童一日 0.1 ml/kg，稀释后静脉输注，输注速率不超过 1 ml/min。在无菌条件下，配制好的输液必须在 24 小时内输注完毕，以免被污染。

【制剂与规格】多种微量元素注射液(Ⅱ)：10 ml。本品渗透压为：1 900 mOsm/(kg · H_2O)，每 10 ml 含氯化铬 53.3 μg、氯化铜 3.4 mg、氯化铁 5.4 mg、氯化锰 0.99 mg、钼酸钠 48.5 μg、亚硒酸钠 105 μg、氯化钠 13.6 mg、碘化钾 166 μg、氯化钠 2.1 mg。

硒酵母[保(乙)]

Selenious Yeast

【适应证】用于低硒的肿瘤、肝病、心脑血管疾病或其他低硒引起的疾病。

【注意事项】(1) 按本说明书用法用量嚼碎后服用。(2) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确，如需要应权衡利弊。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】口服：一次 100 ~ 200 μg，一日 1 ~ 2 次或遵医嘱。

【制剂与规格】硒酵母胶囊：0.143 g(相当于硒 100 μg)。

第12章 妇产科疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 流产
- 妊娠期高血压疾病
- 妊娠晚期引产
- 产后出血
- 羊水栓塞
- 妊娠期肝内胆汁淤积症
- 阴道炎
- 功能失调性子宫出血
- 绝经综合征
- 多囊卵巢综合征
- 子宫内膜异位症
- 妇科恶性肿瘤

12.1 流产、先兆早产及其用药

流产（abortion）：孕妇于12周前终止妊娠者为早期流产，妊娠12周至不足28周终止妊娠者为晚期流产。妊娠满28周至不足妊娠37周间分娩者为早

产（premature delivery），如此期间妊娠期妇女出现规律宫缩，伴有宫颈管进行性缩短，宫口开大＜3 cm 为先兆早产（threatened premature delivery）。

12.1.1 流产、早期先兆流产保胎的药物治疗

①黄体功能不足者，肌内注射黄体酮一次 10 ~ 20 mg，一日或隔日 1 次；或口服黄体酮胶丸一次 200 ~ 300 mg，一日 1 ~ 2 次（在医生指导下使用）。或肌内注射绒促性素（HCG）3 000 U，隔日 1 次。②甲状腺功能低下者，应口服小剂量甲状腺素（见第 5 章内分泌代谢疾病用药）。

12.1.2 晚期流产和先兆早产的药物治疗

无继续妊娠禁忌证者，应用子宫松弛药保胎治疗。主要药物有硫酸镁（用于先兆早产）；β 肾上腺素受体激动药利托君。上述药物使用受限制或无效时，《临床诊疗指南》（妇产科分册）推荐可使用硝苯地平或吲哚美辛的二线药物。①硝苯地平的使用方法为 10 mg 舌下含服，每 6 ~ 8 小时 1 次，应用不应超过 3 日。用药中密切注意妊娠期妇女心率及血压变化。不良反应有母体血压下降，心悸、胎盘血流减少、胎心率减慢。禁忌证为充血性心力衰竭、主动脉瓣狭窄，严重肾脏疾病。对已用硫酸镁者慎用，以防血压急剧下降。②吲哚美辛限在 32 周前短期（1 周）选用。初始剂量 25 ~ 150 mg，每 8 小时 1 次，24 小时后改为 25 mg，应用不超过 3 日。大剂量长期应用可使胎儿动脉导管提前关闭，胎尿减少，肾功能受损。用药期间应检测羊水量和胎儿动脉导管血流。③缩宫素受体拮抗药：阿托西班（疗效比 $β_2$ 受体激动药差，其耐受性好）。

利托君[保（乙）]

Ritodrine

【适应证】用于预防妊娠 20 周以后的早产。

【注意事项】(1) 对于紧急入院的患者，应对子宫颈口的开大、展平及出血情况进行综合评价，制定安全的给药方案后，严密监护下给药，应避免不必要的用药。(2) 诊断为早产并适用本品者，最初用静脉滴注，随后口服维持治疗，密切监测子宫收缩和不良反应，以确定最佳用量。根据孕妇情况，静脉滴注时要经常监测妊娠子宫收缩频率、心率、血压和胎儿的心率。(3) 静脉滴注时，应密切关注胎儿情况，特别是用于急性胎儿窘迫时，如果胎儿情况恶化，需立即停药。胎儿心搏每分钟可能增加 25 次以上，但通常很少见。(4) 为预防由腔静脉症候群引起的低血压，静脉滴注时应保持左侧卧位。(5) 避免用于心脏病或潜在心脏病患者。(6) 糖尿病患者及使用排钾利尿药的患者慎用，在延长输液期间，密切监测有糖尿病患者或服用排钾利尿药患者的生化指标变化。因本品可以升高血糖及降低血钾，停药后 24 小时内转为正常。(7) 本品治疗后曾有孕妇发生肺水肿的报告，引发原因包括患有心脏病、持续性心动过速（超过每分钟 140 次）、子痫以及与皮质类固醇并用，因此要严密监测患者，避免体液过多。如发生肺水肿立即停止用药。(8) 胎儿酸中毒时，继续监测是必要的，少数严重酸中毒（pH ＜ 7.15）的情况，不宜使用。(9) 当使用本品预防早产、延缓分娩时，要考虑是否会有绒毛膜羊膜炎的发生，用药要谨慎。(10) 持续静脉滴注需定期进行血液检查。(11) 滴注药量超过每分钟 0.2 mg 时可能会增加不良反应，应加强监护。

【禁忌证】(1) ＜ 20 周妊娠。(2) 延长妊娠对孕妇和胎儿构成危险的下列情况：①分娩前任何原因的大出血，特别是前置胎盘及胎盘早剥；②子痫及重度子痫前期；③死胎；④绒毛膜羊膜炎；⑤孕妇有心脏病及危及心脏功能的情况；⑥肺性高血压；⑦孕妇甲状腺功能亢进；⑧未控制的糖尿病患者；⑨重度高血压。

【不良反应】(1) 静脉滴注常出现孕妇和胎儿心跳速率增加，对健康孕妇心跳速率宜避免超过每分钟 140 次。适当减少剂量或停止输注会很快恢复正常。(2) 严重不良反应：肺水肿、肺水肿合并心功能不全；白细胞减少、粒细胞缺乏症；心律不齐、在多胎妊娠情况下，可能在给予麻醉药后立即从心律失常转为心搏骤停；横纹肌溶解症（肌肉痛、无力感、CK 升

高、血和尿中的肌红蛋白升高）；新生儿肠闭塞、新生儿心室中隔肥大；因 β_2 受体激动药所致的血清钾低下、休克、黄疸、Stenvens-Johnson 综合征。(3) 其他不良反应：①心血管系统，如室上性心动过速、心悸、有时出现面色潮红、胸痛、呼吸困难、罕见心电图异常（ST-T 的异常）、颜面疼痛，胎儿心动过速、心律不齐；②肝脏系统，如肝功能损害（ALT、AST 等升高）；③血液系统，如血小板减少；④精神神经系统，如震颤、麻木感、头痛、四肢末端发热感、无力感、出汗、眩晕；⑤消化系统，如恶心感、呕吐、便秘、伴淀粉酶升高的涎腺肿胀；⑥过敏症，如皮疹、瘙痒、红斑、肿胀；⑦给药部位血管痛、静脉炎；⑧其他不良反应，如一过性血糖升高、CK 升高、尿糖变化、发热，出冷汗；⑨孕妇用过 β 拟交感神经药，其婴儿有低血钙、低血糖、肠梗阻等症状。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：临用前，将本品 100 mg 用 5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液 500 ml 稀释制成浓度为 0.2 mg/ml 的溶液后缓慢静脉滴注。常用量，初始控制滴速使剂量为每分钟 0.05 mg，以后每 10 分钟按每分钟增加 0.05 mg，直至达到预期效果，通常保持在每分钟 0.15 ~ 0.35 mg，待宫缩停止，继续用药至少 12 ~ 18 小时，随后口服维持治疗。(2) 口服：常用量，最初 24 小时，一次 10 mg，每 2 小时 1 次；此后，一次 10 ~ 20 mg，每 4 ~ 6 小时 1 次。维持量一日 80 ~ 120 mg，一日总量不超过 120 mg，平均分次给药。如有必要延长妊娠时间，可继续口服用药维持治疗。维持治疗应于静脉滴注结束前 30 分钟开始。

【制剂与规格】盐酸利托君片：10 mg。

盐酸利托君注射液：5 ml : 50 mg。

烯丙雌醇 [保（乙）]

Allylestrenol

【适应证】先兆流产、习惯性流产、先兆早产。

【注意事项】(1) 糖尿病孕妇应小心使用，服用本品期间应定期测定血糖水平。(2) 烯丙雌醇是一种具有促孕功能的物质，哺乳期妇女不宜服用高剂量孕激素。

【禁忌证】对烯丙雌醇过敏，严重肝功能障碍，Dubin-Johson 和 Rotor 综合征，既往病史中有过妊娠疱疹或妊娠毒血症患者。

【不良反应】偶有体液潴留，恶心，头痛。

【用法与用量】(1) 先兆流产：一次 5 mg，一日 3 次，5 ~ 7 日，至症状消失。如需要，剂量可适当增加。(2) 习惯性流产：应在明确妊娠后立即用药，一日服用 5 ~ 10 mg，至少维持到危险期后的 1 个月，之后剂量可逐渐减少。(3) 先兆早产：剂量需个体化，通常剂量为一日 5 ~ 20 mg。

【制剂与规格】烯丙雌醇片：5 mg。

阿托西班

Atosiban

【适应证】用于 18 岁以上、孕龄 24 ~ 33 周、胎儿心率正常的孕妇，在其规律性宫缩达每 30 分钟 4 次以上，每次持续至少 30 秒，并伴宫颈扩张 1 ~ 3 cm（初产妇 0 ~ 3 cm）、宫颈管消失 50% 以上的时候，推迟其即将出现的早产。

【注意事项】(1) 胎膜早破的患者慎用。(2) 治疗应在确诊早产后尽快开始。(3) 给药时应监测宫缩和胎儿心率。(4) 宫缩持续存在时，应考虑替换疗法。(5) 本品用于多胎妊娠的疗效尚未确定。

【禁忌证】孕龄少于 24 周或超过 33 周、孕龄超过 30 周胎膜早破、胎儿生长受限和胎儿心率异常、产前子宫出血须立即分娩、子痫和重度子痫前期须分娩、死胎、宫内感染可疑、前置胎盘屏障、胎盘早剥、继续妊娠对母亲或胎儿有危险的患者禁用。

【不良反应】常见恶心、头痛、头晕、潮红、呕吐、心悸、低血压、注射部位反应和高血糖症。少见发热、失眠、瘙痒和出疹。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：常用量初始一次 6.75 mg，静脉注射，注射时间不少于 1 分钟；紧接着以每分钟 300 μg 的速度静脉滴注 3 小时；然后以每分钟 100 μg 的速度静脉滴注适当时间，最长可滴注 45 小时。整个疗程总剂量不

宜超过 330 mg。

【制剂与规格】醋酸阿托西班注射液：① 0.9 ml∶6.75 mg（以阿托西班计）；② 5 ml∶37.5 mg（以阿托西班计）。

12.1.3 促胎肺成熟药

《临床诊疗指南》（妇产科分册）推荐于早产、前置胎盘、胎膜早破，以及各种高危妊娠孕周未满 34 周而 7 日内有可能早产分娩者使用糖皮质激素：地塞米松（见 5.4.4.2）5 mg 肌内注射，每 12 小时 1 次，共 4 次；或倍他米松，肌内注射一次 12 mg，每 12 小时一次，共 2 次。用药 24 小时以上可起到促胎肺成熟作用。

12.2 妊娠期高血压疾病及其用药

妊娠期高血压疾病（hypertensive disorders in pregnancy，HDP）指妊娠 20 周后发生的妊娠期高血压、子痫前期、子痫、慢性高血压并发子痫前期，以及慢性高血压。该病以高血压、蛋白尿为主要特征，伴有全身器官损害，严重者发生抽搐、昏迷、脑出血、心功能衰竭、胎盘早剥、DIC 等。如子痫前期（多系统受累的情况），子痫（HDP 的孕产妇发生抽搐）以及慢性高血压并发先兆子痫。当出现溶血、AST 及 ALT 升高、血小板减少时，称为 HELLP 综合征，此病是妊娠高血压严重的并发症。

依据 2005 年《中国高血压防治指南》的治疗原则：镇静、解痉、降压，适时终止妊娠。①血压 ≥ 160/110 mmHg 或舒张压 ≥ 110 mmHg，或慢性高血压妊娠前已用抗高血压药物者，需降压治疗。②重度子痫前期需给予解痉、降压治疗等。孕周 > 34 周，根据母婴情况，严密监护母婴状况，促胎肺成熟，必要时终止妊娠；孕周达 34 周或积极治疗 24 ～ 48 小时后无明显好转，可考虑终止妊娠；子痫发作需要及时控制抽搐、防治并发症，及时终止妊娠。③子痫，表现为抽搐、面部充血、口吐白沫、深昏迷、肌肉僵硬、全身痉挛，持续 1 ～ 1.5 分钟，其间无呼吸动作，此后抽搐停止，呼吸恢复，但仍昏迷。患者表现为剧烈头痛、视物模糊、颅内出血、充血性心力衰竭、少尿、肾功能不全时，需迅速控制血压；在有效解痉及控制血压的情况下，根据母婴状况，决定分娩时机和方式。

12.2.1 解痉药

首选硫酸镁。用药指征为控制子痫抽搐及防止再抽搐、预防重度子痫前期发展为子痫、子痫前期临产前用药。常用方案：① 25% 硫酸镁静脉滴注。②根据血压情况，可用 25% 硫酸镁 20 ml 加 2% 利多卡因 2 ml，双侧臀肌深部肌内注射。

12.2.2 镇静药

①地西泮（见 1.12）适用于子痫前期抢救用药，10 mg，肌内注射。②冬眠合剂，估计 6 小时内分娩者禁用。多首选冬眠合剂Ⅱ号，即哌替啶 100 mg + 异丙嗪 50 mg，1/2 全量肌内注射或溶于 25% 葡萄糖注射液 10 ml，5 ～ 10 分钟缓慢静脉注射。也可用冬眠合剂Ⅰ号，即氯丙嗪 50 mg + 哌替啶 100 mg + 异丙嗪 50 mg，1/3 ～ 1/2 全量肌内注射或溶于 25% 葡萄糖注射液 10 ml 缓慢静脉注射 5 ～ 10 分钟。用药中应卧床休息，防止突然坐起及站立引起体位性休克。肝功能正常者方可辅助应用。仅用于硫酸镁应用效果不佳时（由于使用中可能使血压急速下降，使肾与子宫胎盘血流量不足，对胎儿不利以及药物对肝有一定损害，现已较少应用）。③其他镇静药：巴比妥类。

12.2.3 抗高血压药

首选肼屈嗪（见 4.3.5）。次选拉贝洛尔（见 4.7），口服，一次 100 mg，一日 2 次，最大量一日 240 mg；硝苯地平（见 4.8.1），口服，一次 10 mg，一日 3 次，24 小时总量不超过 60 mg；尼莫地平（见 1.1.1.4）；甲基多巴（见 4.3.7）。

注意事项：①血压不能降至过低或波动太大，防止发生脑血管意外或胎盘早剥，维持收缩压在 140 mmHg，舒张压在 90 mmHg 为宜。② ACEI 和 ARB 在妊娠期禁忌。③钙离子拮抗药不能与硫酸镁合用。④高血压危象者可选用静脉用拉贝洛尔、尼卡地平、肼屈嗪、硝酸甘油、酚

妥拉明（见 4.3.6）。硝普钠（见 4.3.5），不宜在妊娠期使用。

12.2.4 利尿药

仅限于伴有全身性水肿、急性心力衰竭、肺水肿、脑水肿者，可适当应用呋塞米（见 4.6.2）；甘露醇（见 1.1.2.2）。

硫酸镁[基(基)，保(甲)]

Magnesium Sulfate

【适应证】作为抗惊厥药，用于妊娠期高血压疾病，治疗子痫前期和子痫，也用于早产。

【注意事项】(1) 应用硫酸镁注射液前须查肾功能，肾功能不全者慎用，用药量应减少。(2) 有心肌损害、心脏传导阻滞时应慎用或不用。(3) 每次用药前和用药过程中，定时做膝腱反射检查，测定呼吸次数，观察排尿量，抽血查血镁浓度值，出现膝腱反射明显减弱或消失，或呼吸次数每分钟少于 14 ~ 16 次，每小时尿量少于 25 ~ 30 ml 或 24 小时少于 600 ml，应及时停药。(4) 用药过程中突然出现胸闷、胸痛、呼吸急促，应及时停药，必要时做胸部 X 线片，以便及早发现肺水肿。(5) 如出现急性镁中毒现象，可用钙剂静脉注射解救，常用 10% 葡萄糖酸钙注射液 10 ml 缓慢注射。(6) 保胎治疗时，不宜与 β 肾上腺素受体激动药，如利托君同时使用，否则容易引起心血管的不良反应。

【禁忌证】哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 静脉注射常引起皮肤潮红、出汗、口干等症状，快速静脉注射时可引起恶心、呕吐、心悸、头晕，个别出现眼球震颤，减慢注射速度症状可消失。(2) 肾功能不全，用药剂量大，可发生血镁积蓄，血镁浓度达 5 mmol/L 时，可出现肌肉兴奋性受抑制，感觉反应迟钝，膝腱反射消失，呼吸开始受抑制，血镁浓度达 6 mmol/L 时可发生呼吸停止和心律失常，心脏传导阻滞，浓度进一步升高，可使心搏停止。(3) 连续使用硫酸镁可引起便秘，部分患者可出现麻痹性肠梗阻，停药后好转。(4) 极少数血钙降低，再现低钙血症。(5) 镁离子可自由透过胎盘，造成新生儿高镁血症，表现为肌张力低、吸吮力差、不活跃、哭声不响亮等，少数有呼吸抑制现象。(6) 少数孕妇出现肺水肿。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注：临用前，将本品 2.5 ~ 4 g 用 25% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释后缓慢静脉注射，注射时间 5 分钟；或将本品 15 g（25% 硫酸镁注射液 60 ml）用 5% 葡萄糖注射液 1 000 ml 稀释后缓慢静脉滴注，滴注速度为每小时 1 ~ 2 g。①重度子痫前期和子痫：首次缓慢静脉注射 2.5 ~ 4 g，然后以每小时 1 ~ 2 g 的速度静脉滴注维持，24 小时总量为 30 g，根据膝腱反射、呼吸次数和尿量监测而定。②早产与妊娠期高血压疾病：首次缓慢静脉注射 4 g，然后以每小时 2 g 的速度静脉滴注，直到宫缩停止后 2 小时，以后口服 β 肾上腺素受体激动药维持。

【制剂与规格】硫酸镁注射液：① 10 ml : 1 g；② 10 ml : 2.5 g。

（其他见 11.5）

12.3 引产、产后出血用药

12.3.1 妊娠晚期引产用药

促宫颈成熟药物适用于晚期引产、高危妊娠和过期妊娠。对有阴道分娩条件者，使用前行宫颈 Bishop 评分 < 6 分；胎儿宫内状况评估无胎儿窘迫者；除外药物应用禁忌者。

缩宫素有促宫颈成熟、诱发及加强宫缩的作用；静脉给药能精确控制剂量，出现不良反应时可迅速停药；其促宫颈成熟的作用较前列腺素制剂差。

引产使用原则：①协调性宫缩乏力者第 1 产程潜伏期适当镇静，通过人工破膜、小剂量缩宫素持续静脉滴注；至第 3 产程可增加缩宫素用量。②对不协调性宫缩乏力者治疗原则为调节子宫收缩，恢复其正常节律和极性。适当加用镇静药物，如哌替啶，在恢复为协调宫缩之前，禁用缩宫素。如宫颈未成熟可先用促宫颈成熟药普拉睾酮或地诺前列酮控释阴道栓剂。

缩宫素使用方法：5% 葡萄糖注射液 500 ml 静脉滴注，按每分钟 8 滴调好滴速后，再将缩宫素 2.5 U（0.5%）溶于输液袋中摇匀继续滴入，观察宫缩和胎心，每

15 ~ 20 分钟调整滴速 1 次（按每分钟 8 滴增加），最大滴速小于每分钟 30 滴；若仍未达到有效宫缩，可增加浓度，缩宫素 5 U 溶于 5% 葡萄糖注射液 500 ml（1%），先将滴速减半，再根据宫缩进行调整。如增至每分钟 30 滴仍无有效宫缩，原则上不再增加滴速和浓度。

12.3.2 产后出血的预防和治疗用药

产后出血（postpartum hemorrhage）指胎儿娩出后 24 小时内失血量＞ 500 ml，是导致产妇死亡的首要原因。子宫收缩乏力、胎盘因素（胎盘残留、部分胎盘植入等）、软产道损伤、凝血功能障碍是产后出血的主要原因。尤以子宫收缩乏力最为常见。大量出血又可继发子宫收缩乏力；继而导致凝血因子的减少，继发弥散性血管内凝血（DIC）。产后出血的治疗原则：针对出血原因，有效止血；应用缩宫素；快速建立有效的静脉通道，迅速补充血容量，纠正失血性休克，防止感染；监测凝血功能，适当应用促凝药物，补充凝血因子。

12.3.2.1 产后子宫收缩用药

缩宫素，10 U 静脉入壶，胎儿前肩娩出后或剖宫产胎儿娩出后应用（剖宫产术中可同时宫体注射 10 U）；然后 10 U 溶于氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 500 ml，每分钟 40 ~ 120 滴静脉滴注，速度约每分钟 80 mU，24 小时总量＜ 60 U。

麦角新碱，0.2 ~ 0.4 mg 肌内注射或静脉快速滴注，或加入 25% 葡萄糖注射液 20 ml 中静脉缓慢注射，心脏病、妊娠高血压疾病和高血压患者慎用。

米索前列醇，一次 400 ~ 600μg 顿服或 200μg 舌下含服（缺乏缩宫素注射时用）。可引起全子宫有力收缩，对减少严重产后出血的发生有益。不良反应较大，不推荐重复使用。

卡前列甲酯栓，胎儿娩出后，每粒 1 mg 肛门塞入，预防宫缩乏力所引起的产后出血。

卡前列素氨丁三醇，用于常规处理方法无效的宫缩乏力所致的产后出血及有出血高危因素者预防用药。

12.3.2.2 产后出血其他用药

凝血因子类，可选用纤维蛋白原、凝血酶原、血凝酶、抗纤维蛋白溶解药，治疗凝血功能障碍所致的产后出血。

迅速补充血容量，可采用晶体液、胶体液及血液。输液量为出血量的 2 ~ 3 倍。输液原则为先用晶体液，后用胶体液和血液。两者比例约为 3∶1。输液速度，前 20 分钟内快速输入晶体液约 1 000 ml，第 1 小时内至少输入晶体液 2 000 ml（氯化钠注射液、乳酸钠林格注射液、碳酸氢钠林格注射液）；后输入胶体液 500 ~ 1 000 ml（羟乙基淀粉、低分子右旋糖酐注射液），24 小时内不宜超过 1 000 ml。①失血量 500 ml 左右时，一般仅补充晶体液即可。②失血量为 1 000 ~ 1 500 ml 时，血液及胶体液的补充量应与晶体液相当。③失血量超过 1 500 ml 时，应以补充血液及胶体液为主。当血红蛋白≤ 70 g/L、HCT ≤ 0.24 时，应予输入成分血。每 600 ml 比容血细胞应补充 200 ml 新鲜冷冻血浆。输血时适当补充 10% 葡萄糖酸钙注射液。

缩宫素［基（基），保（甲）］

Oxytocin

【适应证】（1）引产、催产、产后及流产后因宫缩乏力或复旧不良引起的子宫出血。（2）了解胎盘储备功能（缩宫素激惹试验）。

【注意事项】（1）下列情况慎用：心脏病、临界性头盆不称、曾有宫腔内感染史、宫颈手术史、宫颈癌、早产、胎头未衔接、孕妇年龄已超过 35 岁者，用药时应注意胎儿异常及子宫破裂的可能。（2）骶管阻滞时用缩宫素，可发生严重的高血压，甚至脑血管破裂。（3）用药前及用药时需检查及监护：①子宫收缩的频率、持续时间及强度；②孕妇脉搏及血压；③胎儿心率；④静止期间子宫肌张力；⑤胎儿成熟度；⑥骨盆大小及胎先露下降情况；⑦出入液量的平衡（尤其是长时间使用者）。

【禁忌证】骨盆过窄、产道受阻、明显头盆不称及胎位异常、有剖宫产史、子宫肌瘤剔除术史者脐带先露或脱垂、前置胎盘、胎儿窘迫、宫缩过强、子宫收缩乏

力长期用药无效、产前出血（包括胎盘早剥）、多胎妊娠、子宫过大（包括羊水过多）、严重的妊娠期高血压疾病等患者。

【不良反应】(1) 偶见恶心、呕吐、心率加快或心律失常。(2) 大剂量应用时可引起高血压或水潴留。

【用法与用量】静脉滴注：(1) 引产或催产，一次 2.5 ～ 5 U。滴注开始时每分钟不超过 0.001 ～ 0.002 U，每 15 ～ 30 分钟增加 0.001 ～ 0.002 U，至达到宫缩与正常分娩期相似，最快每分钟不超过 0.02U，通常为每分钟 0.002 ～ 0.005 U。(2) 控制产后出血，每分钟 0.02～0.04 U。胎盘排出后肌内注射 5 ～ 10 U。用于肌内注射时，本品可直接使用；用于静脉滴注时，临用前，将本品 2.5 ～ 5 U 用氯化钠注射液适量稀释制成每 1ml 中含有 0.01 U 的溶液后缓慢滴注。

【制剂与规格】缩宫素注射液：① 0.5 ml：2.5 U；② 1 ml：5 U；③ 1 ml：10 U。

卡贝缩宫素 [保(乙)]

Carbetocin

【适应证】卡贝缩宫素用于选择性硬膜外或腰麻醉下剖宫产术后，以预防子宫收缩乏力和产后出血。

【注意事项】(1) 单剂量注射后，一些患者可能没有产生足够的子宫收缩，此时，不能重复给药，但可用附加剂量的其他子宫收缩药如缩宫素或麦角新碱进行更进一步的治疗。(2) 对持续出血的病例，需要排除胎盘碎片的滞留、凝血疾病或产道损伤。(3) 对于血管疾病，特别是冠状动脉疾病的患者慎用；老年患者不推荐使用。

【禁忌证】妊娠期和胎儿娩出前妇女禁用，对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见恶心、腹痛、呕吐、瘙痒、面红、热感、低血压、头痛和震颤。不常发生的是背痛、头晕、金属味、贫血、出汗、胸痛、呼吸困难、寒战、心动过速和焦虑。

【用法与用量】单剂量静脉注射 100 μg (1 ml) 卡贝缩宫素，只有在硬膜外或腰麻醉下剖宫产术完成婴儿娩出后，缓慢地在 1 分钟内一次性给予。卡贝缩宫素可以在胎盘娩出前或娩出后给予，或遵医嘱。

【制剂与规格】卡贝缩宫素注射液：1 ml ：100 μg。

麦角新碱 [基(基)，保(甲)]

Ergometrine

【适应证】用于产后子宫出血、产后子宫复旧不全、月经过多等。

【注意事项】(1) 子宫复旧不全时常伴有子宫腔内感染，单用麦角制剂有使感染扩散的危险性，一般宜联合应用抗感染药。(2) 全麻醉时本品可加强外周血管收缩的作用，雷诺病患者应用后可加重症状。(3) 大量吸烟者应用后易发生血管收缩或痉挛。(4) 与升压药合用，可引起剧烈头痛，并有发生高血压、脑出血的危险。(5) 肝、肾功能不全者慎用。

【禁忌证】有妊娠期高血压疾病、冠心病者禁用。于胎儿及胎盘未娩出前禁用，以免发生子宫破裂及胎儿窘迫，死胎。

【不良反应】常见皮肤瘙痒、四肢疼痛、腰痛、手足苍白、出汗、四肢无力、呼吸短促；偶见有高血压、剧烈头痛、抽搐；长期大量应用可致中毒，表现为恶心、呕吐、腹泻、昏迷、脉弱等。

【用法与用量】肌内注射或静脉注射：用于产后出血、子宫复旧不良，一次 0.1～0.5 mg，必要时每隔 2 ～ 4 小时重复给药，但最多限定 5 次，极量一日 1 mg。子宫颈注射：用于产后止血，一次 0.2 mg，注射于子宫颈的左右两侧。

【制剂与规格】麦角新碱片：① 0.2 mg；② 0.5 mg。

麦角新碱注射液：① 1 ml：0.2mg；② 1ml：0.5 mg。

地诺前列酮 [保(乙)]

Dinoprostone

【适应证】用于中期妊娠引产、足月妊娠引产和治疗性流产，对妊娠期高血压疾病、妊娠合并心肾疾患、过期妊娠、死胎、葡萄胎、胎膜早破、高龄初产妇等均可应用。

【注意事项】(1) 在使用之前，应对

患者的适应证和宫颈条件仔细加以评估。(2) 曾有子宫收缩过强、青光眼和哮喘的患者慎用。(3) 阴道置入栓剂后，子宫的活动和胎儿的情况需定期检测，若有任何母婴并发症和不良反应的征象，应将栓剂从阴道中取出。(4) 当宫颈完全成熟或出现以下情况时应取出栓剂：临产，不管宫缩情况如何，出现每3分钟1次的规律性宫缩；自然破膜或人工破膜；有子宫过度刺激或子宫强直性收缩的迹象；胎儿窘迫；产妇对本品发生系统性不良反应的症状，如恶心、呕吐、低血压和心动过速；在静脉给缩宫素之前。(5) 如宫缩过强且时间太长，应立即取出栓剂。(6) 破膜前预期生产时如欲施以硬膜外麻醉，应取出栓剂。(7) 在应用本品之前，应停用非甾体抗炎药，包括阿司匹林。

【禁忌证】(1) 已开始临产、已破膜、正在给缩宫素的患者。(2) 患盆腔炎或有盆腔炎史、多胎妊娠的患者。(3) 不能有持续强而长的宫缩的患者，如有子宫手术史、有宫颈手术史、严重头盆不称、胎先露异常、可疑胎儿窘迫、难产或创伤性生产史、3次以上足月产。

【不良反应】(1) 胎儿电子监护仪描记的改变，提示胎儿窘迫。(2) 子宫活动增加和子宫收缩过强伴或不伴胎儿窘迫。(3) 胃肠道反应如恶心、呕吐和腹泻等。(4) 子宫破裂。(5) 罕见生殖器水肿。

【用法与用量】 阴道给药：一次1枚(10 mg)，将栓剂放在后穹窿处，使用少量润滑剂以助放置。放入后，确保患者卧床休息20～30分钟。如8～12小时未达充分的宫颈成熟，应取出，可再放入第2枚，第2枚亦应在不超过12小时取出。在1个疗程中不应超过2枚。

【制剂与规格】地诺前列酮栓：10 mg。

普拉睾酮[保(乙)]

Prasterone

【适应证】用于妊娠足月引产前使宫颈成熟。

【注意事项】(1) 胎儿生长受限及经产道分娩有困难的孕妇慎用。(2) 心功能不全、肝肾功能损害者慎用。(3) 本品宜在阵痛诱发剂和阵痛促进剂前列腺素、缩宫素给药前使用。

【禁忌证】妊娠未足月，无引产指征者。

【不良反应】可见眩晕、耳鸣、恶心、呕吐、皮疹、手肿。

【用法与用量】静脉注射：临用前，将本品100～200 mg用5%葡萄糖注射液10 ml溶解后缓慢静脉注射，注射时间不少于1分钟。常用量一次100～200 mg，一日1次，连续3日。

【制剂与规格】注射用硫酸普拉睾酮：100 mg。

卡前列甲酯[保(乙)]

Carboprost Methylate

【适应证】(1) 与米非司酮序贯合并使用，用于终止停经49日内的早期妊娠。(2) 用于预防和治疗宫缩乏力所引起的产后出血。

【注意事项】(1) 终止早期妊娠，本品不宜单独使用，须与米非司酮序贯合并使用。(2) 本品特别适合高危妊娠者，如多次人流史、子宫畸形、剖宫产后以及哺乳期妊娠者。(3) 本品不能用做足月妊娠引产。(4) 糖尿病、高血压及严重心肝肾功能不全者慎用。(5) 本品应在医师监护下使用，如发现不可耐受性呕吐、腹痛或阴道大出血，应立即停药。(6) 使用时必须戴无菌手套将药品置入阴道，以免发生继发感染。

【禁忌证】(1) 前置胎盘及异位妊娠、急性盆腔感染、胃溃疡患者。(2) 哮喘及严重过敏体质、心血管疾病、青光眼等有使用前列腺素禁忌的患者。

【不良反应】(1) 常见腹泻、恶心或呕吐、腹痛等胃肠道症状，采用服用复方地芬诺酯片后，不良反应显著减少。停药后上述反应即可消失。(2) 少见面部潮红，但能很快消失。(3) 一般不良反应包括心血管系统症状等。

【用法与用量】外用：①用于终止妊娠，停经不超过49日的健康早孕妇女，空腹或进食2小时后口服米非司酮，首剂200 mg，然后禁食2小时，第3日晨于阴道后穹窿放置卡前列甲酯栓1 mg；或口服米非司酮，首剂50 mg，当晚再服25 mg，以后每隔12小时服25 mg，第3

日早晨口服米非司酮 25 mg 后 1 小时于阴道后穹窿放置卡前列甲酯栓 1 mg，卧床休息 2 小时，门诊观察 6 小时。注意用药后出血情况，有无妊娠物排出和不良反应。②用于预防和治疗宫缩乏力所引起的产后出血，于胎儿娩出后，立即戴无菌手套将卡前列甲酯栓 1 mg 放入阴道，贴附于阴道前壁下 1/3 处，约 2 分钟。

【制剂与规格】卡前列甲酯栓：①0.5mg；②1 mg。

米索前列醇[保(乙)]

Misoprostol

【适应证】本品与米非司酮序贯合并使用，用于终止停经 49 日内的早期妊娠。

【注意事项】(1) 本品用于终止早孕时，必须与米非司酮配伍，严禁单独使用。(2) 本品配伍米非司酮终止早孕时，必须经医师处方，并在医师监管下有急诊刮宫手术和输液、输血条件的单位使用。本品不得在药房自行出售。(3) 给药前必须向服药者详细告知治疗效果及可能出现的不良反应。治疗或随诊过程中，如出现大量出血或其他异常情况应及时就医。(4) 服药后，一般会较早出现少量阴道出血，部分妇女流产后出血时间较长。少数早孕妇女服用米非司酮后，即可自然流产，约 80%的孕妇在使用本品后，6 小时内排出绒毛胎囊。约 10%孕妇在服药后 1 周内排出妊娠物。(5) 服药后 8 ~ 15 日应去原治疗单位复诊，以确定流产效果。必要时做 B 超检查或血人绒毛膜促性腺激素 (HCG) 测定，如确认为流产不全或继续妊娠，应及时处理。(6) 使用本品终止早孕失败者，必须进行人工流产终止妊娠。

【禁忌证】(1) 心、肝、肾疾病患者及肾上腺皮质功能不全者。(2) 有使用前列腺素类药物禁忌者，如青光眼、哮喘及过敏体质者。(3) 带宫内节育器妊娠和怀疑异位妊娠者。(4) 除终止早孕妇女外，其他孕妇。

【不良反应】见 3.1.3。

【用法与用量】口服：在服用米非司酮 36 ~ 48 小时后，单次空腹口服米索前列醇 0.6 mg。

【制剂与规格】米索前列醇片：0.2 mg。

卡前列素氨丁三醇[保(乙)]

Carboprost Tromethamine

【适应证】(1) 用于妊娠期为 13 ~ 20 周的流产，此妊娠期从正常末次月经的第 1 日算起。(2) 用于下述与中期引产有关的情况：①其他方法不能将胎儿排出；②采用宫内方法时，由于胎膜早破导致药物流失，子宫收缩乏力；③需要进行宫内反复药物滴注的流产，以使胎儿排出；④尚无生存活力的胎儿出现意外的或自发性胎膜早破，但无力将胎儿排出。(3) 用于常规处理方法无效的宫缩乏力引起的产后出血现象。

【注意事项】(1) 青光眼或有眼压升高史者、哮喘病、高血压、低血压、贫血、黄疸、糖尿病、癫痫者慎用。(2) 子宫瘢痕者慎用。(3) 大剂量可引起子宫破裂。(4) 必须严格遵循推荐剂量使用。

【禁忌证】盆腔炎性疾病患者，有活动性心、肺、肾、肝疾病的患者。

【不良反应】一般为暂时性的，治疗结束后可恢复。常见呕吐、腹泻、恶心，还可出现面部潮红和体温升高等。在用药前或同时给予止吐药或止泻药，可使前列腺素类药物的胃肠道不良反应发生率大为降低。

【用法与用量】肌内注射：①用于流产和适应证第 2 项的内容，起始剂量为 250μg，用结核菌素注射器做深部肌内注射。此后依子宫反应，间隔 1.5 ~ 3.5 小时再次注射 250μg 的剂量。首次可使用的试验剂量 100μg。多次注射 250μg 剂量后子宫收缩力仍不足时，剂量可增至 500μg。②用于难治性产后子宫出血，初始一次 250μg，做深部肌内注射。如疗效不满意时，可间隔 15 ~ 90 分钟多次注射，注射次数和间隔时间应根据病情决定，24 小时总剂量不得超过 2 mg。

【制剂与规格】卡前列素氨丁三醇注射液：1 ml：0.25 mg。

12.4 产科特有疾病及其用药

12.4.1 羊水栓塞及其药物治疗

羊水栓塞（amniotic fluid embolism）是指在分娩过程中，羊水进入母体血循环后引起的一系列病理改变，临床表现为急性肺栓塞、过敏性休克、弥散性血管内凝血（DIC）及急性肾衰竭。严重者可发生猝死。发生在足月分娩者病死率高达80%。诱发因素包括宫缩过强、急产、胎膜早破或人工破膜、前置胎盘、子宫破裂、剖宫产、过期妊娠、巨大儿等。

羊水栓塞的治疗：①解除肺动脉及支气管痉挛药物。首选罂粟碱(见 1.1.1.4)，30 ~ 90 mg 溶于 10% 葡萄糖液 20 ml，缓慢静脉注射，1 小时后可重复；其他可选用阿托品（见 3.1.4.1)、酚妥拉明（见 4.3.6)、氨茶碱（见 2.3.3)。②抗过敏药物，地塞米松。③纠正休克药物。④纠正心力衰竭用药。⑤纠正酸中毒药物。⑥早期防治 DIC：肝素。⑦抗纤溶药（已过早期高凝状态，发现纤溶亢进)，氨甲环酸、氨基已酸；同时补充凝血底物新鲜冷冻血浆、纤维蛋白原或凝血酶原、血小板等。⑧防止肾衰竭药，呋塞米（见 4.6.2)。

12.4.2 妊娠期肝内胆汁淤积症及其药物治疗

妊娠期肝内胆汁淤积症（intrahepatic cholestasis of pregnancy，ICP）主要发生在妊娠中、晚期，以皮肤瘙痒和胆酸增高为特征，危及胎儿宫内状况。确定诊断主要依靠实验室检查，血清胆酸增高是早期诊断方法，可伴有转氨酶及血清胆红素的轻度升高。治疗目的为缓解瘙痒症状，恢复肝功能，降低血清胆酸水平，改善胎儿宫内状况和妊娠结局，及时发现胎儿宫内缺氧并积极采取措施。

降低血清胆酸水平，改善瘙痒症状药物：腺苷甲硫氨酸为 ICP 首选，一日 500 ~ 2 000 mg，静脉滴注，连续 2 周后改口服。熊去氧胆酸按体重一日 15 mg/kg，分 3 次口服，共 20 日，间隔 2 周，再用 20 日；苯巴比妥；地塞米松。维生素 K_1 10 mg 肌内注射，一日 1 次；维生素 AD 胶丸，一日 1 粒口服。

12.5 盆腔炎性疾病和阴道炎及其用药

12.5.1 盆腔炎性疾病（pelvic inflammatory）

见第 9 章 感染疾病用药。

12.5.2 外阴阴道假丝酵母菌病的药物治疗

下述的氟康唑、伊曲康唑见第 9 章感染疾病用药，咪康唑、克霉唑、制霉菌素见第 16 章皮肤科疾病用药。

外阴阴道假丝酵母菌病（vulvovaginal candidiasis，VVC）表现为严重的外阴瘙痒及疼痛，阴道分泌物中找到假丝酵母菌的芽胞及菌丝即可确诊。初患者为单纯性 VVC，分为局部治疗和口服治疗；每年发作 4 次或 4 次以上称为复发性假丝酵母菌病（RVVC)。

12.5.2.1 单纯性外阴阴道假丝酵母菌病的药物治疗

①局部治疗：首选硝酸咪康唑（2% 乳膏、栓剂 400 mg/ 枚、200 mg/ 枚）乳膏每晚就寝前用涂药器将药膏（约 5 克）挤入阴道深处，必须连续用 2 周；栓剂，1 枚，阴道上药，每晚 1 次，连续 7 天。次选克霉唑（3% 乳膏，阴道片剂 500 mg/ 片，栓剂 150 mg/ 枚、300 mg/ 枚)，乳膏每晚就寝前用涂药器将药膏挤入阴道深处，阴道片 500 mg 剂量 1 片为 1 个疗程；栓剂，1 枚，阴道上药，每晚 1 次，连续 7 ~ 14 天；制霉菌素（栓剂、阴道用泡腾片）每枚 10 万 U，阴道给药，每晚 1 次，7 ~ 14 日。②口服药：氟康唑 150 mg，顿服。伊曲康唑 200 mg，一日 2 次，连续 1 ~ 3 日。酮康唑因肝损害较重，目前已较少应用。

12.5.2.2 复发性外阴阴道假丝酵母菌病的药物治疗

①初始治疗：若选择局部治疗，延长治疗时间至 7 ~ 14 日；口服药物首次氟康唑 150 mg，72 小时时再加服 1 次。②巩固治疗：口服氟康唑 150 mg，一周 1 次，连续 6 个月或局部阴道用克霉唑栓

500 mg，一周 1 次，连续 6 个月。

12.5.2.3 妊娠合并外阴阴道假丝酵母菌病的药物治疗

外用药物阴道局部治疗，禁用口服药物。可选用制霉菌素栓剂、克霉唑栓及硝酸咪康唑栓，7 日疗法效果较好。

12.5.3 滴虫阴道炎及其药物治疗

下述的甲硝唑、替硝唑见第 9 章抗感染用药。

滴虫阴道炎（trichomonal vaginitis）由毛滴虫引起的阴道炎症。可同时有尿道、尿道旁腺、前庭大腺滴虫感染，须全身用药。本病为性传播性疾病，需要同时治疗性伴侣。常用药物治疗：①全身用药。初次治疗首选甲硝唑一次 0.4 g，一日 2 次，连续 7 日；或甲硝唑 2 g，单次口服。次选替硝唑 2 g，单次口服；替硝唑一次 0.5 g，一日 2 次，连续 7 日。②局部用药：适用于不能耐受口服药物或不适宜全身用药者。单纯局部用药有效率≤ 50%。甲硝唑阴道泡腾片 200 mg，每晚 1 次，连续 7 日。③性伴侣治疗：甲硝唑 0.4 g，一日 2 次，连续 7 日，治疗期间禁止性生活或带避孕套。

12.5.4 细菌性阴道病及其药物治疗

细菌性阴道病（bacterial vaginosis）为阴道内正常菌群失调所致的一种混合感染。治疗选用抗厌氧菌药物，主要为甲硝唑、克林霉素。①口服药物：甲硝唑使用方法同滴虫阴道炎。克林霉素一次 0.3 g，一日 2 次，连续 7 日。②局部药物治疗：2% 克林霉素软膏阴道上药，一次 5 g，一日 1 次，连续 7 日，或甲硝唑泡腾片 200 mg，一日 1 次，7 ～ 14 日。局部用药与口服用药疗效相似，治愈率为 80% 左右。性伴侣不需常规治疗。③妊娠期细菌性阴道病的治疗：由于本病与妊娠不良结局有关，对任何有症状的妊娠期妇女及无症状的高危妊娠期妇女（有胎膜早破、早产史）均需进行细菌性阴道病的筛查及治疗，多选择局部给药，甲硝唑方法同上。

聚甲酚磺醛 [保（乙）]

Policresulen

【适应证】(1) 妇科：用于宫颈糜烂、宫颈炎、各类阴道感染（如细菌、滴虫和真菌引起的白带增多）、外阴瘙痒、使用子宫托造成的压迫性溃疡、宫颈息肉切除或切片检查后的止血，尖锐湿疣及加速电凝治疗后的伤口愈合；还可用于乳腺炎的预防（乳头皲裂的烧灼感）。(2) 外科与皮肤科：用于皮肤伤口与病变的局部治疗（如烧伤、肢体溃疡、压疮、慢性炎症等），能够加速坏死组织的脱落、止血和促进愈合过程及用于尖锐湿疣的治疗。(3) 口腔科：用于口腔黏膜和齿龈的炎症，口腔溃疡及扁桃体切除后的止血。

【注意事项】(1) 本药为外用药，禁止内服。同时避免接触眼睛，如误入眼内，应立即冲洗。(2) 治疗期间避免使用刺激性肥皂清洗患处，同时避免在同一部位应用其他药物。(3) 月经期间应停药，用药期间应避免性交。(4) 药物接触棉织品或皮革后，应在制剂未干前洗净。(5) 本药栓剂上的斑点是其基质产生的自然现象，不影响药物的使用及疗效，也不影响其耐受性。(6) 本药能加速和增强修复过程，用药后可出现大片坏死组织脱落，为药物治疗的正常反应。(7) 用药器具使用后应放在水中浸泡。(8) 应用本药治疗宫颈糜烂前，应进行宫颈细胞学涂片以排除癌变。(9) 治疗阴道局部病变时，可采用本药溶液阴道敷贴或与栓剂合用。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 偶可引起局部刺激症状（如烧灼感及疼痛），通常可耐受，并会很快消失。(2) 本药溶液用于治疗口腔病变时，可能损伤牙釉质。

【用法与用量】成人局部用药。(1) 妇科：①聚甲酚磺醛溶液：阴道冲洗，对本药按 1 ∶ 5 的比例用水稀释，通常烧灼每周进行 1 ～ 2 次，治疗前先彻底清洁宫颈及宫颈管，去除分泌物，为此可将浸有聚甲酚磺醛原液的棉签插入宫颈管，转动数次取出，然后再将浸有药液的纱布块轻轻敷贴于病变组织，持续 1 ～ 3 分钟；局部涂抹或敷贴，此时则无需稀释，用法用

量同阴道冲洗；止血，用浸有本药溶液（无需稀释）的棉片压于出血部位1～2分钟，即可止血。②聚甲酚磺醛栓：用于治疗宫颈糜烂、宫颈炎、各类阴道感染、外阴瘙痒、使用子宫托造成的压迫性溃疡，每2日将1粒栓剂放入阴道。如果采用本药溶液病灶烧灼，则于两次烧灼间隔日放入1粒栓剂。为了使用方便，患者最好取仰卧位，先将栓剂用水浸湿，然后插入阴道深部。通常以晚间睡前用药为宜，配合使用卫生带，防止污染衣物和被褥。(2)外科和皮肤科：将浸有本药溶液的纱布块压在出血部位1～2分钟，止血后最好擦干残留药液。治疗局部烧伤、压疮和肢体溃疡也可采用同样方法，以使其坏死组织易于脱落。这些病例若继续使用本药凝胶则疗效更佳。(3)口腔科：用法与用量同外科和皮肤科。口腔黏膜与牙龈病变患者，在使用本药溶液治疗后，必须彻底漱口。

【制剂与规格】聚甲酚磺醛溶液：①10 ml：3.6 g；②100 ml：36 g。

聚甲酚磺醛阴道栓剂：3 g：90 mg。

硝呋太尔[保（乙）]

Nifuratel

【适应证】治疗由细菌、滴虫、真菌和念珠菌引起的外阴、阴道感染和白带增多。

【注意事项】(1)为获得良好疗效，请尽量将阴道片置入阴道深部，第二日清晨应进行阴道清洗。(2)为防止阴道片折碎，应小心拿放，并用剪刀沿线剪开包装材料。(3)治疗期间应避免性生活。(4)使用硝呋太尔治疗期间请勿饮用乙醇饮料，乙醇会引起不适应或恶心，但这种反应会自行消失。

【禁忌证】对硝呋太尔过敏者禁用。

【不良反应】大量临床使用本品很少产生急、慢性不良反应。

【用法与用量】阴道感染：于每晚临睡前将阴道片一枚置于阴道深部，连续使用10日，如外阴同时有感染，可用2～3 g油膏涂于外阴和肛门周围。

【制剂与规格】硝呋太尔阴道片：250 mg。

硝呋太尔制霉素阴道软胶囊：每粒含硝呋太尔0.5 g与制霉素200 000 U。用于细菌性阴道病、滴虫性阴道炎、念珠菌性外阴阴道炎、阴道混合感染。用法：阴道给药，一日1次，于晚上临睡前清洗外阴后，将本品1粒放入阴道后穹窿处，连用6日。建议使用1～2个疗程或遵医嘱。

乳杆菌活菌[保（乙）]

Living Preparation of Lactobacillus

【适应证】用于由菌群紊乱而引起的细菌性阴道病的治疗。

【注意事项】(1)治疗期间应避免性生活。(2)勿同时使用抗菌类药物。(3)用药期间不可冲洗阴道。(4)适宜于冷藏保存。(5)本品不能用于由滴虫、真菌、淋球菌、衣原体等引起的阴道病的治疗。(6)妊娠及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】尚无资料报道。

【不良反应】尚未发现。

【用法与用量】清洁外阴后，戴上指套，将本品放入阴道深部，一次1粒，每晚1次，连用10日为1个疗程。

【制剂与规格】阴道用乳杆菌活菌胶囊：0.25 g（每粒内含乳杆菌活菌应不低于2.5×10^5CFU）。

12.5.5 萎缩性阴道炎及其药物治疗

萎缩性阴道炎（atrophic vaginitis）绝经后雌激素水平降低，阴道黏膜变薄，上皮细胞内糖原含量减少，阴道内pH增高，局部抵抗力低下，致病菌容易入侵繁殖引起炎症。常见病原菌有金黄色葡萄球菌、白葡萄球菌、甲型链球菌、乙型链球菌、大肠埃希菌等。治疗原则为抑制细菌生长及增加阴道抵抗力。

(1)抑制细菌生长：局部用药为甲硝唑泡腾片、复方莪术油。全身用药为甲硝唑、克林霉素。

(2)雌激素制剂：①局部阴道给药。己烯雌酚0.125～0.25 mg，一日1次，连续7日；0.5%己烯雌酚软膏，一日1次，连续7日；结合雌激素软膏，一日2次，连续7日；雌三醇乳膏，用法见后。②全身用药。尼尔雌醇，首次口服4 mg，以后2 mg，1～2周1次；己烯雌酚0.125～

0.25 mg，一日 1 次，连续 10 日；结合雌激素片 0.625 mg，一日 1 次，连续 1 ～ 2 个月。雌激素依赖性肿瘤（乳腺癌或子宫内膜癌）禁用。使用雌激素治疗老年性阴道炎，应定期检查乳腺及子宫。

复方莪术油栓 [保（乙）]

Compound Zedoary Turmeric Oil Suppositories

【适应证】用于外阴阴道炎症、宫颈炎。

【注意事项】(1) 本品仅供阴道给药，切忌口服。(2)使用本品时应避开月经期。(3) 给药时应洗净双手或戴指套或手套。(4) 用药期间注意个人卫生，防止重复感染，使用避孕套或避免房事。(5) 用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净。(6) 当本品性状发生改变时禁用，但于夏季本品可能变软，可在冰箱冷冻层放置片刻后使用。

【禁忌证】妊娠初始 3 个月内妇女及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】偶见局部刺激，瘙痒或烧灼感。

【用法与用量】阴道给药：(1) 术前用药，一日 2 次，于每晚及次晨各 1 枚，连用 1 周。(2) 各种阴道炎症，一日 1 次，一次 1 枚，6 日为 1 个疗程，连用 2 个疗程。临床症状严重者，一日 2 次，于每晚及次晨各 1 枚，6 日为 1 个疗程，连用 2 个疗程。(3) 宫颈炎：一日 1 次，一次 1 枚，6 日为 1 个疗程，连用 2 个以上疗程。症状重者一日 2 次，一次 1 枚，6 日为 1 个疗程，连用 3 ～ 4 个疗程，或至 5 ～ 7 个疗程。乳头型合并宫颈腺体囊肿者，可采用碘酊（0.5%）局部消毒，用穿刺针头刺破囊肿壁，使液体流出后使用本品，一日 2 次，一次 1 枚，6 日为1 个疗程，连用 5 ～ 7 个疗程。

【制剂与规格】复方莪术油栓：每枚含硝酸益康唑 50 mg，莪术油 0.2 ml，冰片 3 mg。

雌三醇

Estriol

【适应证】雌激素缺乏引起的泌尿生殖道萎缩性症状；预防复发性阴道和尿道下部的感染；绝经后妇女阴道术前和术后；可疑的萎缩性宫颈涂片辅助诊断。

【注意事项】每天请勿超过一次（雌三醇 0.5 mg），并不要连续使用数周。长期使用雌激素治疗，应当进行定期体检。对于阴道感染，建议同时采取对症性治疗。病人如发生下列任何现象，应该监测：血栓栓塞史，隐性或显形心脏病，肾功能障碍引起的体液潴留，高血压，癫痫或偏头痛（或有过去史），严重肝病，子宫内膜异位症，纤维囊性乳腺病，卟林症，高脂蛋白血症，妊娠期或使用固醇类时曾发生过严重瘙痒，胆汁淤积性黄疸或疱疹。雌三醇可能会进入乳汁，可能降低乳汁分泌量。如果放置的药物过多，可能会发生恶心，呕吐和撤退性出血，如果有必要，可对症治疗。

【禁忌证】妊娠；血栓；已知或怀疑的雌激素依赖性肿瘤；不明原因的阴道出血；在妊娠期间或过去使用固醇类药物时发生过耳硬化症或该症状加重；哺乳期。

【不良反应】局部灼热或瘙痒。乳房胀痛偶尔发生，这也表明剂量过高。

【用法与用量】①每次（给药器上标有装药刻度）用药 0.5 mg，晚上就寝之前通过给药器送至阴道。第 1 周内每天使用 1 次，然后根据症状缓解情况逐渐减低至维持量(例如每周使用 2 次)。②尿失禁，有些妇女可能需要较高的维持量。③在手术前两周每天 1 次；术后两周内每周 2 次。在下次涂片检查之前一周内每两天 1 次。

【制剂与规格】雌三醇乳膏：15 g ∶ 5 mg

克霉唑 [保（甲）]

Clotrimazole

【适应证】由真菌，通常是念珠菌引起的阴道炎症；由酵母菌引起的感染性白带以及由克霉唑敏感菌引起的二重感染。

【注意事项】在下述情况下使用应特别小心，并在医师指导下应用：(1) 第一次患有阴道真菌感染。(2) 在过去的 12 个月中，这种真菌感染发作超过 4 次。(3) 妊娠期治疗最好由医师进行或不使用投药器。

【禁忌证】18 岁以下患者禁用。

【不良反应】用药面部有烧灼感、刺痛及颜色变红。个别出现不同程度的过敏反应，如皮肤瘙痒、红斑、呼吸短促、血压下降、意识障碍、恶心及腹泻。

【用法与用量】阴道给药睡前将药置于阴道深处，一次1片，一般用药1次即可，必要时可在4日后进行第二次治疗。

【制剂与规格】克霉唑阴道片：0.5g。

克霉唑阴道栓：① 0.15g；② 0.3g。

12.6 女性激素失调疾病及其用药

12.6.1 功能失调性子宫出血及其药物治疗

功能失调性子宫出血（dysfunctional uterine bleeding，简称功血）是由于下丘脑-垂体-卵巢轴、神经内分泌机制失常引起卵巢性激素分泌失调所致的异常子宫出血，分为无排卵性和排卵性两类。

12.6.1.1 无排卵性功能失调性子宫出血及其药物治疗

(1) 青春期功血：月经失去规律性，间隔时间时长时短，一般出血时间长，不易自止；可引起严重贫血或休克。治疗原则应用常规止血药，最主要应用性激素调整月经周期。

用于止血。①复方口服避孕药一次1片，每6～8小时1次。血止后每3日递减1/3直至维持量（一日1片），共21日。②雌激素：结合雌激素，口服，1.25mg，或微粒化雌二醇2mg，每4～6小时1次，血止连续3日后减量1/3，此后每3日减量1/3，直到维持量每日1次，待血红蛋白水平和患者一般情况允许时加用孕激素；苯甲酸雌二醇，肌内注射，首剂2mg，每4～6小时1次，血止后开始减量，每3日以1/3递减，直到维持量一日1mg，改用口服雌激素片剂，当血红蛋白＞100g/L时，可考虑加用孕激素引起撤退性出血；结合雌激素，肌内注射，25mg，每4～6小时可重复1次，一般用药2～3次，次日给予口服结合雌激素，一日3.75～7.5mg，并逐渐减量，持续21日，第11日起加用孕激素。适用于贫血严重，血红蛋白＜80g/L患者。③孕激素：黄体酮注射液20mg，肌内注射，一日1次，共3～5日，酌情加用止血药3～5日以减少撤退性出血；地屈孕酮，口服，一次10mg，一日2次，连续5～7日。黄体酮胶囊，一日200mg，3～5日；醋酸甲羟孕酮，口服，一日6～10mg，连续5～7日。注意事项为患者的血红蛋白＞80g/L才可以此法止血。最常选用天然黄体酮。对青春期发育中的下丘脑-垂体-卵巢轴作用较强，不作为首选药物。④左炔诺孕酮宫内缓释系统：患者无生育要求，可在月经第7日内将其放入宫内，作用可维持5年。

用于调整月经周期。①口服避孕药，血止后，周期性使用口服避孕药（去氧孕烯/炔雌醇片、孕二烯酮/炔雌醇片），一日1片，21日为1个周期，连续3个周期，停药后观察月经。②雌、孕激素序贯法：用结合雌激素，一次0.625mg，一日1次，21日为1个周期，最后10日同时服用孕酮制剂如甲羟孕酮4mg，一日2次，连续使用3～6个周期。③孕激素：在撤退性出血第15日起，使用孕酮制剂如地屈孕酮，一日10～20mg，或甲羟孕酮一日4～12mg，分2～3次；连续10～14日为1个周期，使用3～6个周期。

用于促排卵。①有生育要求者可用氯米芬，也适用于对于垂体轴功能低落的闭经者。可先给予雌孕激素替代治疗3个周期，再应用氯米芬促排卵；氯米芬无反应的患者可以采用尿促性素（HMG）。②如为高泌乳素血症所致无排卵，应选用溴隐亭，一日5～7.5mg，需定期复查PRL浓度，以调整剂量。用法：第1周一次1.25mg，每晚1次；第2周一次1.25mg，一日2次；第3周，一日晨服1.25mg，每晚服2.5mg；第4周后一次2.5mg，一日2次，连续3个月为1个疗程。

(2) 围绝经期功血：多见于40岁以后至绝经前妇女。应用激素类药物前，应注意除外子宫颈、子宫内膜、子宫肌瘤等器质性病变。①孕激素，适用于血红蛋白＜70g/L患者。炔诺酮，一次5mg，每8小时1次，血止后逐步减量，每3日减1次，减量不应超过1/3，至维持量一日2.5～5mg，血止后21日停药；甲

羟孕酮6～8 mg，每8小时1次，依上法递减至维持量一日4～6 mg，共10～12日；口服短效避孕药去氧孕烯/炔雌醇片或孕二烯酮/炔雌醇片，起始剂量一次2～4片，每6～8小时1次，血止后逐步减量，每3日减1次，减量不应超过1/3，血止后维持21日左右。用药注意事项为有血栓性疾病、心脑血管疾病高危因素及35岁以上吸烟的女性不宜应用。②雄激素：丙酸睾酮，一日50 mg，肌内注射，总量小于每月300 mg。③雌、孕激素联合用药，用法，在撤退性出血的第5日起口服短效避孕药。④孕激素月经后半周期用药：在撤退性出血的第16日起一日肌内注射黄体酮20 mg，共5日；口服甲羟孕酮每日10 mg，共10日；口服地屈孕酮，一日20 mg，分2次，连续10日。⑤左炔诺孕酮宫内缓释系统。

12.6.1.2 排卵性月经失调的药物治疗

排卵性月经失调多发生在育龄妇女，应根据不同临床表现予以治疗。①月经过多，指连续数个周期经期出血量多（>80 ml），月经周期和经期都正常。止血药氨甲环酸适用于无避孕要求或不愿激素治疗者。左炔诺孕酮宫内缓释系统。②经间出血（围排卵期出血）是由于发育中卵泡夭折引起血雌二醇波动，波动或排卵前血雌二醇下降过多或内膜对血雌二醇波动过于敏感而引起，表现为经期≤7日，血停数日后又出血，量少，持续3～5日。可应用止血药对症治疗。③经前出血：排卵后黄体酮一日20 mg，肌内注射，共7～10日；排卵后绒促性素（HCG）一日1 000 U，一日1次肌内注射，共5～7次；HCG一日2 000 U，隔日1次肌内注射，共3～4次。促排卵可应用氯米芬。④子宫内膜不规则脱落，表现为月经延长；应用黄体酮、氯米芬。

12.6.2 绝经综合征及其药物治疗

绝经综合征指妇女绝经前后出现性激素波动或减少所致的一系列躯体及精神心理症状。表现为月经紊乱、潮热、出汗、心悸、头痛、失眠、焦虑不安、抑郁、记忆力下降、阴道干燥、尿痛、排尿困难、骨质疏松等。

（1）治疗方法为对症治疗，可应用艾司唑仑、口服谷维素、激素替代（HT）及补充钙剂和维生素D。HT注意事项：①有无使用雌激素禁忌证，如乳腺癌、子宫内膜癌、生殖道异常出血、6个月内活动性血栓病、肝肾功能异常、脑膜瘤等。②有子宫者必须加用孕激素10～12日。③使用最低有效剂量。④进行HT的妇女至少每年就诊1次，包括体格检查、病史的更新、相关实验室检查和影像学检查以及对生活方式的探讨，以评价是否可以继续使用HT。

（2）激素类药物：①雌激素，如结合雌激素、戊酸雌二醇、尼尔雌醇、17β-雌二醇（片剂）、17β-雌二醇（皮肤贴剂每1～2周更换1次）。②孕激素，如醋酸甲羟孕酮、黄体酮胶囊、左炔诺孕酮宫内缓释系统、地屈孕酮。③组织选择性雌激素活性调节剂，如替勃龙。④选择性雌激素受体调节剂（SERM），如雷洛昔芬，口服一日60 mg，预防骨质疏松，长期应用有发生静脉血栓的可能。

（3）给药途径及方案：①口服，雌激素+周期性孕激素（雌、孕激素序贯法）；雌激素+连续性孕激素，每日同时口服雌激素及孕激素，不发生撤退性出血，但有不规则点滴出血，适用于绝经多年妇女；单用雌激素治疗，适用于子宫已切除者。②胃肠道外途径：经阴道给药，结合雌激素软膏、雌三醇软膏，主要用于治疗下泌尿生殖道局部低雌激素症状，经皮肤给药，包括皮肤贴膜和涂胶，主要为17β-雌二醇，一周1～2次。

（4）不良反应及危险性：①子宫出血，多为突破性出血，必要时诊刮排除子宫内膜癌。②性激素不良反应，如乳房胀痛、白带增多、头痛、抑郁、高脂血症等。③长期单用雌激素可增加子宫内膜癌的危险。④乳腺癌和绝经后HT的相关程度仍存在争议，有研究认为，雌、孕激素联合治疗超过5年乳腺癌的风险增加。

12.6.3 多囊卵巢综合征及其药物治疗

本病原因不明，临床表现为月经稀发或闭经、多毛、肥胖、卵巢多囊样改变。

根据高雄激素、B超可见一侧或双侧卵巢直径2～9 mm的卵泡≥12个和（或）卵巢体积≥10 ml，以上3个标准中占有2项，即可诊断。治疗以调整内分泌紊乱、保护子宫内膜、促使妊娠为主。

（1）调整内分泌紊乱用药：①降低雄激素治疗，主要采用短效口服避孕药，可以选择皮质激素泼尼松或地塞米松。②调节血糖代谢异常，如二甲双胍（见5.1.2.1）。

（2）保护子宫内膜用药：黄体酮、短效口服避孕药。

（3）促使妊娠用药：促排卵治疗药物氯米芬、尿促性素（HMG）。

12.7 子宫内膜异位症及其药物治疗

子宫内膜异位症，指具有生长功能的子宫内膜组织出现在子宫腔被覆内膜及子宫体肌层以外的其他部位。异位的子宫内膜可以侵犯全身任何部位，但绝大多数位于盆腔内，其中宫骶韧带、子宫直肠陷凹及卵巢为最常见的侵犯部位。因其病变部位不同而有多样性。常见有痛经、慢性盆腔痛、性交痛、月经异常和不孕。

治疗上应根据患者的年龄、症状、病变部位、范围以及对生育的要求等采用个体化治疗。目前以腹腔镜诊断／治疗及药物治疗为子宫内膜异位症主要治疗方法。药物治疗包括对症治疗和性激素抑制治疗。激素抑制治疗包括假孕治疗、假绝经治疗和其他治疗。

（1）孕三烯酮（Gestrinone）。

（2）促性腺激素释放激素激动药（GnRH-a）。目前常用的GnRH-a类药物有亮丙瑞林，戈舍瑞林、曲普瑞林。均于月经第1日首次注射，后每隔28日注射1次，共3～6次。注意事项包括，首次注射后20日左右可能出现少量阴道不规则出血，不影响疗效，无须特殊处理；应用GnRH-a 3个月应给予反向添加治疗，即结合雌激素0.3～0.625 mg加甲羟孕酮2～4 mg，一日1次或替勃龙每日1.25 mg，直至疗程结束，有条件者监测血E_2水平，使其维持在30～50 pg/ml。同时口服钙制剂，以防止骨质丢失。③达那唑。

（3）口服避孕药，服用6个月。

（4）孕激素类药物如醋酸甲羟孕酮、甲地孕酮、炔诺酮。

（5）对症治疗：主要用来缓解慢性盆腔痛和痛经，不能阻止病情进展。前列腺素合成酶抑制药可减少前列腺素的释放，防止子宫肌收缩过强和痉挛，减轻疼痛。常用药有吲哚美辛、布洛芬、双氯芬酸等。

己烯雌酚[保（甲）]

Diethylstilbestrol

【适应证】（1）补充体内雌激素不足，如萎缩性阴道炎、女性性腺发育不良、绝经综合征、老年性外阴萎缩、阴道干燥及萎缩性阴道炎、卵巢切除后、原发性卵巢缺如。（2）乳腺癌、绝经后及男性晚期乳腺癌，不能进行手术治疗者。（3）前列腺癌，不能手术治疗的晚期患者。（4）预防产后泌乳、退（或回）乳。

【注意事项】（1）心功能不全、癫痫、糖尿病、肝肾功能障碍、抑郁症患者慎用。（2）长期使用应定期检查血压、肝功能，每年一次宫颈防癌刮片。

【禁忌证】（1）有血栓性静脉炎和肺栓塞性病史患者。（2）与雌激素有关的肿瘤患者及未确诊的阴道不规则流血患者、高血压患者。（3）孕妇。

【不良反应】（1）不规则的阴道流血、子宫肥大、尿频或小便疼痛。（2）引发血栓症以及心功能不全。（3）引起肝功能损害、高脂血症、钠潴留。（4）恶心、呕吐、畏食。（5）头痛、头晕等精神症状。

【用法与用量】（1）口服：①补充体内雌激素不足，一日0.25～0.5 mg，21日后停药1周，周期性服用，一般可用3个周期（自月经第5日开始服药）。②乳腺癌，一日15 mg，6周内无改善则停药。③前列腺癌，开始时一日1～3 mg，依据病情递增而后递减；维持量一日1 mg，连用2～3个月。④预防产后泌乳、退乳，一次5 mg，一日3次，连服3日。（2）肌内注射：一次0.5～1 mg，一日0.5～6 mg。

【制剂与规格】己烯雌酚片：① 0.5 mg；② 1 mg；③ 2 mg。

己烯雌酚注射液：①1ml ：0.5mg；②1 ml：1 mg；③ 1 ml：2 mg。

结合雌激素[保（乙）]

Conjugated Estrogen

【适应证】(1) 治疗中、重度与绝经相关的血管舒缩症状。(2) 治疗外阴和阴道萎缩。(3) 预防和控制骨质疏松症。当仅为预防和控制骨质疏松症时，应仅对有明显骨质疏松危险的妇女和被认为不适合非雌激素疗法的妇女才考虑使用。(4) 治疗因性腺功能减退、去势或原发性卵巢功能衰退所致的雌激素低下症。(5) 治疗某些女性和男性的转移性乳腺癌（仅做症状缓解用）。(6) 治疗晚期雄激素依赖性前列腺癌（仅做症状缓解用）。

【注意事项】(1) 在雌激素应用周期中加用孕激素 10 日或 10 日以上，较单用雌激素治疗可减少子宫内膜增生。(2) 对绝经后妇女，雌激素替代治疗与心血管疾病减少的因果关系尚未证实。(3) 在开始用雌激素治疗之前，要取得完整的病史及家族史。治疗前及周期性的体格检查必须特别注意包括血压、乳房、腹部和盆腔器官，以及巴氏涂片作为常规，在未对患者复查时，开具雌激素处方不能超过 1 年。(4) 用雌激素替代治疗的妇女有高凝状态，主要与抗凝血酶活性下降有关。(5) 有家族性脂蛋白代谢缺陷的患者，雌激素治疗会大量增加三酰甘油而导致胰腺炎和其他并发症。(6) 雌激素可致某种程度的体液潴留，加重下列病情，如哮喘、癫痫、偏头痛、心肾功能不全，必须密切观察。(7) 有些患者可出现意外的雌激素刺激症状，如异常子宫出血和乳房痛。(8) 肝功能损害的患者可能影响雌激素的代谢，应慎用。(9) 在雌激素应用期间，使用前已经存在的子宫平滑肌瘤的体积可增大。(10) 在患有与骨代谢疾病相关的严重低钙血症的患者，应慎用雌激素。(11) 在进行可能增加血栓栓塞疾患危险性的手术前 4 周或长期不活动时，应停止使用雌激素。(12) 在动物，长期持续使用天然或合成雌激素可使乳腺癌、子宫癌、宫颈癌、阴道癌、睾丸癌及肝癌发生率增加。

【禁忌证】(1) 已知或怀疑妊娠的患者。(2) 未确诊的异常生殖器出血患者。(3) 已知或怀疑患有乳腺癌患者（治疗某些转移性癌的患者除外）。(4) 已知或怀疑患有雌激素依赖性肿瘤的患者。(5) 活动性血栓性静脉炎或血栓栓塞性疾病患者。(6) 以前患有与使用雌激素相关的血栓性疾病患者。

【不良反应】(1) 诱发恶性肿瘤。(2) 在绝经期后接受雌激素治疗的妇女中，患需手术治疗的胆囊疾病的危险性增加 2 ~ 4 倍。(3) 雌激素替代治疗（HT），可增加患血栓性静脉炎和（或）血栓栓塞性疾病的危险性。(4) 在 HT 期间通常血压维持正常或下降，偶有血压升高。(5) 乳腺癌和骨转移患者应用雌激素可能会导致严重的高钙血症。(6) 阴道出血形式改变、异常撤退性出血、点状出血、子宫平滑肌瘤体积增大，阴道念珠菌病、宫颈分泌物量的改变。(7) 乳房触痛、增大。(8) 恶心、呕吐、腹绞痛、腹胀、胆汁淤积性黄疸、胆囊疾病发生率增加、胰腺炎。(9) 停药后黄褐斑或黑斑病持续存在、多形性红斑、红斑结节、红斑疹、头发脱落、妇女多毛症。(10) 静脉血栓栓塞、肺栓塞。(11) 眼角膜弯曲度变陡、对接触镜耐受性下降。(12) 头痛、偏头痛、头晕、精神抑郁、舞蹈病。(13) 体重增加或减轻、糖耐量下降、卟啉症加重、水肿、性欲改变。

【用法与用量】(1) 口服：①用于与绝经相关的中、重度血管舒缩状态，一次 0.625 mg，一日 1 次；②外阴和阴道萎缩，一次 0.3 ~ 1.25 mg，一日 1 次；③女性性腺功能减退，一次 0.3 ~ 0.625 mg，一日 1 次，按用药 3 周，停药 1 周的周期性服用；④女性去势或卵巢早衰，一次 1.25 mg，一日 1 次，周期性服用，维持量调整至能有效控制病情的最小剂量；⑤乳腺癌，一次 10 mg，一日 3 次，至少 3 个月为 1 个疗程；⑥雄激素依赖的前列腺癌，一次 1.25 ~ 2.5 mg，一日 3 次；⑦预防骨质疏松，一次 0.625 mg，一日 1 次，可以连续用药，或按用药 25 日，停药 5 日的周期用药。(2) 肌内注射或静脉注射：体内激素水平失衡引起的异常子宫出血，一次 25 mg，必要时 6 ~ 12 小时重复 1 次。(3) 阴道内给药：外阴和阴道

萎缩，一日 0.5～2 g，通过给药器将乳膏推入阴道深处。乳膏阴道内给药应该短期、周期性使用，如连续使用 3 周，停用 1 周。对于症状特别明显的患者，可以首先接受短期口服治疗（如结合雌激素一日 0.625 mg 服用，10 日左右），以便使阴道黏膜能够适应乳膏涂敷。

【制剂与规格】结合雌激素片：① 0.3 mg；② 0.625 mg。

结合雌激素注射液：1 ml ∶ 25 mg。

结合雌激素乳膏：1g : 0.625 mg。

尼尔雌醇[保（乙）]

Nilestriol

【适应证】用于雌激素缺乏引起的绝经综合征，如潮热、出汗、头痛、目眩、疲劳、烦躁易怒、神经过敏、外阴干燥、老年性阴道炎等。

【注意事项】每 2 个月应给予孕激素 10 日以抑制雌激素的内膜增生作用，一般孕激素停用后可产生撤退性子宫出血。如使用者已切除子宫，则不需加用孕激素。

【禁忌证】(1) 有雌激素依赖性疾病如乳腺癌、子宫内膜癌、宫颈癌、较大子宫肌瘤等病史患者。(2) 血栓病、高血压病患者。

【不良反应】(1) 可见恶心、呕吐、腹胀、头痛、头晕。(2) 突破性出血。(3) 乳房胀痛，白带增多。(4) 高血压。(5) 偶有肝功能损害。

【用法与用量】口服：一次 5 mg，1 个月 1 次；或一次 2 mg，每 2 周 1 次。症状改善后用维持量，一次 1～2 mg，1 个月 2 次，3 个月为 1 个疗程。

【制剂与规格】尼尔雌醇片：① 1 mg；② 2 mg；③ 5 mg。

雌二醇[保（乙）]

Estradiol

【适应证】(1) 补充雌激素不足。常用于治疗女性性腺功能不良、双侧卵巢切除术后、萎缩性阴道炎、外阴干燥、绝经综合征（如潮热、出汗和精神、神经症状）等。(2) 治疗晚期转移性乳腺癌，缓解症状。(3) 治疗晚期前列腺癌，缓解症状。(4) 用于停经早期预防由于雌激素缺乏而引起的骨质快速丢失。(5) 治疗痤疮（粉刺），在男性可用于较重的病例，在女性可选用雌、孕激素复合制剂。(6) 用于恶性肿瘤经化疗或放疗引起的白细胞减少症。(7) 用作事后避孕药。(8) 退乳。

【注意事项】(1) 皮肤涂抹或使用贴片时：①勿涂抹或贴在乳房或外阴；②患有皮肤病和皮肤过敏者不宜使用；③应注意贴片脱落，不宜在热水盆浴浸泡时间过长，避免直接搓擦贴片部位皮肤，脱落后应换新片，贴用时间与脱落片时间一致，按原定日期更换；④凝胶使用时间最好在每日早晨或晚间沐浴后，涂药后稍等片刻，等药物干后再穿内衣。(2) 应与孕激素联合应用，以对抗单纯雌激素引起的子宫内膜增生而导致子宫内膜腺癌。联合应用方法有两种，为序贯连续应用和联合连续应用。绝经时间较短的妇女可用前种方法，绝经较久的妇女可用后种方法以减少前种方法引起的子宫周期性出血。

【禁忌证】严重的肝功能异常、黄疸、妊娠期间持续瘙痒史、Dubin-Johnson 综合征、Rotor 综合征、曾患或正患肝脏肿瘤、曾患或正患血栓栓塞性疾病（如卒中、心肌梗死）、镰刀状红细胞性贫血症、患有或疑有子宫或乳房的激素依赖性肿瘤、子宫内膜异位症、严重糖尿病、脂肪代谢的先天性异常、耳硬化症史等患者。

【不良反应】(1) 不常见或罕见但应注意的不良反应：①不规则阴道出血、点滴出血、突破性出血、长期出血不止或闭经；②困倦；③尿频或小便疼痛；④严重的或突发的头痛；⑤行为突然失去协调，不自主的急动作（舞蹈病）；⑥胸、上腹、腹股沟或腿痛，尤其是腓肠肌痛，臂或腿无力或麻木；⑦呼吸急促，突然发生，原因不明；⑧突然语言或发音不清；⑨视力突然改变（眼底出血或血块），血压升高，乳腺出现小肿块，精神抑郁，眼结膜或皮肤黄染（注意肝炎或胆道阻塞），皮疹，黏稠的白色凝乳状阴道分泌物（念珠菌病）。(2) 较常发生，但常在继续用药后减少：①腹部绞痛或胀气；②食欲缺乏；③恶心；④踝及足水肿；⑤乳房胀痛和（或）肿胀；⑥体重增加或减少。(3) 应用贴片时，贴片局部皮肤可发生瘙痒、充

血潮红、皮疹或水疱，严重时可脱皮。

【用法与用量】(1) 口服：雌二醇片，一次 1 mg，一日 1 次。如有子宫，应加用孕激素。(2) 外用：①雌二醇凝胶，1 次 1.25 ~ 2.5 g，一日 1 次，涂抹下腹部、臀部、上臂、大腿等处皮肤。②雌二醇控释贴片，揭除贴片上的保护膜后立即贴于清洁干燥、无外伤的下腹部或臀部皮肤。人体皮肤平均渗透量为一日 50μg。周效片，一次 1 片，一周 1 次(每 7 日更换 1 片)；3 ~ 4 日片，一次 1 片，一周 2 次（每 3.5 日更换 1 片）。连用 3 周，停药 1 周。每个疗程于使用贴片的最后 5 日加用醋酸孕酮，一次 4 ~ 5 mg，一日 1 次，连服 5 日。贴片的部位应经常更换。

【制剂与规格】雌二醇片：1 mg。

雌二醇凝胶：40 g : 24 mg。

雌二醇控释贴片：①周效片，4.0 cm × 2.6 cm，含 2.5 mg；② 3 ~ 4 日效片，4.0 cm × 2.6 cm，含 4 mg。

戊酸雌二醇 [保(乙)]

Estradiol Valerate

【适应证】(1) 补充雌激素不足，如萎缩性阴道炎、女性性腺功能不全、外阴干燥症、绝经期血管舒缩症状、卵巢切除、卵巢早衰等。(2) 晚期前列腺癌。(3) 与孕激素合用作避孕药。

【注意事项】(1) 开始治疗前，应进行全面、彻底的内科及妇科检查（包括乳房检查及宫颈的细胞涂片）。(2) 出现以下情况应立即停药：第一次发生偏头痛或频繁发作少见的严重头痛、突发性感觉障碍（如视觉或听觉障碍）、血栓性静脉炎或血栓栓塞的前发指征（如异常的腿痛或腿肿、不明原因的呼吸或咳嗽时的刺痛感）、胸部疼痛及紧缩感、发生黄疸、肝炎、全身瘙痒、癫痫发作次数增加、血压显著增高。(3) 糖尿病、高血压、静脉曲张、耳硬化症、多发性硬化、癫痫、卟啉症、手足抽搐、小舞蹈病患者及有静脉炎病史的患者，须在临床严密监护下用药。(4) 个别良性或恶性肝脏肿瘤患者，服用激素类药物后，可能发生危及生命的腹腔内出血。(5) 围绝经期的长期非对抗性雌激素治疗，可能会增加子宫内膜癌的发病率，故子宫内膜增生应避免行非对抗性的雌激素治疗，而应另外给予孕激素类药物。(6) 手术前（提前 6 周）及肢体固定术（如事故后）时应停用本品。

【禁忌证】(1) 严重的肝功能异常、黄疸、妊娠期间持续瘙痒史、Dubin-Johnson 综合征、Rotor 综合征、曾患或正患肝脏肿瘤、曾患或正患血栓栓塞性疾病（如卒中、心肌梗死）、镰刀状红细胞性贫血症、患有或疑有子宫或乳房的激素依赖性肿瘤、子宫内膜异位症、严重糖尿病、脂肪代谢的先天性异常、耳硬化症史等患者。（2）孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】少见乳房胀感、胃部不适、恶心、头痛、体重和性欲改变、不规则阴道出血。

【用法与用量】(1) 口服：一次 1 mg，一日 1 次，餐后服。按周期序贯疗法，每经过 21 日的治疗后，须停药至少 1 周。(2) 肌内注射：①补充雌激素不足，一次 5 mg，每 4 周 1 次；②前列腺癌，一次 30 mg，每 1 ~ 2 周 1 次，按需调整用量。

【制剂与规格】戊酸雌二醇片：1 mg。

戊酸雌二醇注射液：① 1 ml : 5mg；② 1 ml : 10 mg。

苯甲酸雌二醇 [保(乙)]

Estradiol Benzoate

【适应证】(1) 补充雌激素不足，如萎缩性阴道炎、女性性腺的功能不良、外阴干枯症、绝经期血管舒缩症状、卵巢切除、原发卵巢衰竭等。(2) 晚期前列腺癌。(3) 与孕激素类药合用，用于避孕。(4) 用于产后退乳。

【注意事项】(1) 用药期间定期进行妇科检查。(2) 子宫肌瘤、心脏病、癫痫、糖尿病及高血压患者慎用。

【禁忌证】(1) 血栓性静脉炎、肺栓塞患者，肝、肾疾患者。(2) 与雌激素有关的肿瘤，如乳腺癌、阴道癌、卵巢癌，子宫颈癌患者。(3) 孕妇及正在哺乳的妇女禁用，用于退乳时需停止哺乳。

【不良反应】可见恶心、头痛、乳房胀痛，偶见血栓症、皮疹、水钠潴留等。

【用法与用量】(1) 肌内注射：①用于绝经期综合征，一次 1 ~ 2 mg，一周

2～3次。②子宫发育不良，一次1～2 mg，每2～3日1次。③功能性子宫出血，一次1～2 mg，一日1次，至血净后酌情减量，后期择日用黄体酮撤退。④退乳，一次2 mg，一日1次，连用不超过3日，然后减量或改小剂量口服药至生效。(2) 外用：一次1.5 g，涂于手臂内侧、下腹部、腰部、臀或大腿等部位的干净皮肤上，一日1次，每月按月历1～24日连用，15～24日每日并用口服甲羟孕酮片4 mg。

【制剂与规格】苯甲酸雌二醇注射液：①1 ml∶1 mg；②1 ml∶2 mg。

苯甲酸雌二醇软膏：1.5 g∶1.35 mg。

普罗雌烯[保(乙)]

Promestriene

【适应证】外阴、前庭部及阴道环部的萎缩性病变。

【注意事项】哺乳期妇女不推荐使用。

【禁忌证】对本品过敏者、妊娠妇女禁用。

【不良反应】局部刺激、瘙痒、局部过敏反应等。

【用法与用量】阴道给药。乳膏剂：一日1～2次，根据医嘱的时间，将足量乳膏涂于需要治疗部位的表面。胶囊剂：将湿润过的胶囊放入阴道深部，通常一次10 mg，一日1次，20日为1个疗程。如果病因持续（如绝经、卵巢切除、使用雌-孕激素避孕），或影响因素持续（如放射疗法）存在，则有必要进行持续治疗。

【制剂与规格】普罗雌烯乳膏：10 g∶0.1 g。

普罗雌烯阴道胶囊：10 mg。

替勃龙[保(乙)]

Tibolone

【适应证】用于自然绝经或手术绝经引起的各种症状。

【注意事项】(1) 本品不可作为避孕药使用。(2) 妇女绝经前并有正常周期者如服用本品，其正常周期可能被干扰，故建议用于绝经1年以后的妇女。(3) 不规则阴道出血发生在用药1个月后或用药期间，应查明原因。(4) 如已用其他激素替代疗法而要改服本品时，宜先用孕激素撤退出血后再开始服用，以免因子宫内膜已增厚而引起出血。(5) 长期服用者应定期进行体检。(6) 少数患者在服药期间可出现阴道出血，如服用高于规定剂量的药品时，引起阴道出血的比例会更高，应定期加服孕激素。(7) 如出现静脉栓塞征象、肝功能异常、胆道阻塞性黄疸则应立即停药。(8) 患者如有下述情况应严密观察：①肾病，癫痫或偏头痛，三叉神经痛及有上述疾病史者，因本品偶尔可引起液体潴留；②高脂血症，尤其是低密度脂蛋白增高者，因在服用本品者中曾发现血脂变化；③糖代谢异常者，本品可减低糖耐量，因此需要增加胰岛素或其他降糖药的用量。(9) 服用本品期间，患者对抗凝剂的敏感性增强。(10) 应定期检查乳房，子宫内膜增生情况和可能出现的男性化体征。

【禁忌证】(1) 已确诊或疑有激素依赖性肿瘤患者。(2) 血栓性静脉炎、血栓栓塞形成等心血管疾病或脑血管疾病，或者有上述疾病既往史患者。(3) 原因不明的阴道出血患者。(4) 严重肝功能不全患者。(5) 孕妇。

【不良反应】可见体重变化、眩晕、皮脂分泌过多、皮肤病、阴道出血、头痛、肠胃不适、肝功能指标变化、面部毛发生长增加、胫骨前水肿。

【用法与用量】口服：一次1.25～2.5 mg，一日1次。最少连续治疗3个月方能达到最好的疗效。

【制剂与规格】替勃龙片：2.5 mg。

甲羟孕酮[基(基)，保(甲/乙)]

Medroxyprogesterone

【适应证】(1) 月经不调、功能性子宫出血及子宫内膜异位症等。(2) 用于不能手术、复发性或转移性激素依赖性肿瘤的姑息治疗或辅助治疗，如晚期乳腺癌、子宫内膜癌。

【注意事项】(1) 心功能不全、肾功能不全、癫痫、偏头痛、哮喘者及糖尿病患者慎用。(2) 有抑郁症病史的患者慎用，若忧郁复发至严重程度须停药。(3) 一旦出现增强凝血机制而致血栓栓塞症状，如偏头痛、视力减退、复视等情况应立即停

药。(4) 连续大剂量治疗时，应注意有无高血压、水钠潴留、高钙血症倾向等，如出现这些症状应调整用药。

【禁忌证】(1) 各种血栓栓塞性疾病（血栓性静脉炎、肺栓塞等）、严重肝功能损害、因骨转移产生的高钙血症、血尿及月经过多患者。(2) 孕妇或哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 乳房痛、溢乳、闭经、子宫颈柱状上皮异位或子宫颈分泌改变以及男性乳房女性化。(2) 精神方面：神经质、失眠、嗜睡、疲乏、头晕。(3) 皮肤与黏膜：包括瘙痒、麻疹、血管神经性水肿至全身性皮疹等过敏反应，以及痤疮、秃头或多毛。(4) 胃肠道：恶心、消化不良、类似肾上腺皮质激素反应及高血钙反应及阻塞性黄疸。

【用法与用量】口服：①功能性闭经，一次 4 ~ 8 mg，一日 1 次，连服 5 ~ 10 日。②子宫内膜癌，一次 100 mg，一日 3 次，或一次 500 mg，一日 1 ~ 2 次，作为肌内注射后的维持量。③各种癌症患者恶病质及疼痛的姑息治疗，一次 500 mg，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】醋酸甲羟孕酮片：① 1 mg；② 2 mg；③ 5 mg；④ 50 mg；⑤ 250 mg。

甲地孕酮[保(乙)]

Megestrol

【适应证】(1) 治疗月经失调、功能性子宫出血、子宫内膜异位症。(2) 晚期乳腺癌和子宫内膜腺癌。

【注意事项】(1) 对未控制的糖尿病及高血压患者慎用。(2) 不主张用于乳腺癌的术后辅助治疗。

【禁忌证】严重血栓性静脉炎、血栓栓塞性疾病、严重肝功能损害和因骨转移产生的高钙血症患者。

【不良反应】(1) 体重增加。(2) 罕见血栓栓塞，包括血栓性静脉炎及肺动脉栓塞。(3) 乳房痛、溢乳、阴道出血、月经失调、面部潮红。(4) 糖皮质激素作用与不良反应，如满月脸、高血压、高血糖。(5) 子宫出血、恶心、呕吐、呼吸困难、心力衰竭、皮疹。

【用法与用量】口服：片剂、膜剂。①闭经（雌激素水平足够时），一次 4 mg，一日 2 ~ 3 次，连服 6 ~ 10 日，停药 2 周内即有撤退性出血。②功能性子宫出血，一次 4 mg，每 8 小时 1 次，每 3 日减量 1 次，减量不超过原剂量的 1/2，直至维持量每日 4 mg，连续 21 日。③子宫内膜异位症，一次 4 ~ 8 mg，一日 1 ~ 2 次，自月经第 5 日服，连服 3 ~ 6 个月。④乳腺癌，一次 40 mg，一日 4 次，一日量 160 mg，连续 2 个月。⑤子宫内膜癌，一次 10 ~ 80 mg，一日 4 次，或一次 160 mg，一日 1 次。

【制剂与规格】醋酸甲地孕酮片：① 1 mg；② 4 mg；③ 40 mg；④ 160 mg。

醋酸甲地孕酮纸片：① 1 mg；② 4 mg。

醋酸甲地孕酮分散片：160 mg。

醋酸甲地孕酮膜剂：① 1 mg；② 4 mg。

地屈孕酮[保(乙)]

Dydrogesterone

【适应证】用于治疗内源性孕酮不足引起的疾病，如痛经、子宫内膜异位症、继发性闭经、月经周期不规则、功能性失调性子宫出血、经前期综合征、孕激素缺乏所致先兆性流产或习惯性流产、黄体不足所致不孕症。

【注意事项】(1) 与雌激素联合使用进行激素替代治疗时应注意雌激素的禁忌和注意事项。(2) 长期采用孕激素雌激素联合用药者应每年定期进行全面体检，包括妇科及乳房线检查。(3) 出现不正常的阴道出血时，应做进一步的检查。(4) 应用于习惯性流产或先兆性流产时，应确定胎儿是否存活。(5) 治疗过程中，应检查妊娠是否继续和（或）胎儿是否存活。(6) 以孕激素为主要成分的口服避孕药可能会增加抑郁症的机会。(7) 有抑郁症史的患者在孕激素治疗过程中，应密切观察。(8) 孕激素治疗掩盖更年期的发生。(不规则月经周期)。

【禁忌证】地屈孕酮与所有孕激素产品一样，不宜用于下列情况：不明原因阴道出血、严重肝功能障碍、肝脏肿瘤（现病史或既往史）Dubin Johson 综合征、Potor 综合征、黄疸、妊娠期或应用性缴素时产生（加重）的疾病（症状）如严重

瘙痒症、阻塞性黄疸、妊娠期疱疹、卟啉症和硬化症；已知对地屈孕酮过敏者。

【不良反应】极少数病人可出现突破性出血，一般增加剂量即可防止。其他不良反应如轻微出血、经期血量的改变、闭经；不适、呕吐、腹痛；肝功能改变、黄疸（少见）；乳房疼痛；瘙痒、皮肤过敏、荨麻疹、抑郁情绪、头痛、偏头痛、精神紧张；水肿；性欲改变。

【用法与用量】口服：(1) 痛经从月经周期的第5至第25日，一次10 mg，一日2次。(2) 子宫内膜异位症从月经周期的第5至第25日，一次10 mg，一日2～3次。(3) 功能性出血止血的剂量：一次10 mg,，一日2次，连续5～7日。预防出血的剂量：从月经周期的第11～25日，一次10 mg，一日2次。(4) 闭经从月经周期的第1至第25日，口服雌二醇，一次1 mg，一日1次。从月经周期的第11至第25日，联合用地屈孕酮，一次10 mg，一日2次。(5) 经前期综合征从月经周期的第11至第25日，一次10 mg，一日2次。月经不规则从月经周期的第11至第25日，一次10 mg，一日2次。(6) 先兆流产 起始剂量为1次40 mg，随后每8小时服10 mg，至症状消失。(7) 习惯性流产一次10 mg，一日2次，至怀孕20周。(8) 内源性孕酮不足导致的不孕症月经周期的第14至第25日，一次10 mg，一日1次。治疗应至少持续6个连续的周期，建议在妊娠的前几个月里连续采用该方法治疗，剂量应参照习惯性流产治疗剂量。

【制剂与规格】地屈孕酮片：10 mg。

炔诺酮[保（乙）]

Norethisterone

【适应证】用于月经失调、功能性子宫出血、子宫内膜异位症等。

【注意事项】(1) 妊娠4个月内慎用，不宜用作早孕试验。(2) 心血管疾病、高血压、肾功能损害、糖尿病、哮喘病、癫痫、偏头痛、未明确诊断的阴道出血、有血栓病史（晚期癌瘤治疗除外）、胆囊疾病和有精神抑郁症史患者慎用。(3) 长期用药需注意检查肝功能，特别注意乳房检查。

【禁忌证】严重肝肾功能不全、乳房有肿块患者、孕妇。

【不良反应】可见恶心、头晕、倦怠和突破性出血。

【用法与用量】口服：①功能性子宫出血，一次5 mg，每8小时1次，连用3日，血止后，改为每12小时1次，7日后改为一次2.5～3.75 mg，一日1次维持，连用2周左右。②痛经或子宫内膜增生，一次2.5 mg，一日1次，连用21日，下次用药将于月经周期的第5日开始，用法同上。3～6个周期为1个疗程。③子宫内膜异位症，一次10～30 mg。开始时一日10 mg，每2周后增加5 mg，最高为一日30 mg，分次服用，连用6～9个月。

【制剂与规格】炔诺酮片：① 0.625 mg；② 2.5 mg；③ 3 mg；④ 5 mg。

黄体酮[基（基），保（甲／乙）]

Progesterone

【适应证】用于先兆流产和习惯性流产、经前期紧张综合征、无排卵性功血和无排卵性闭经、与雌激素联合使用治疗更年期综合征。

【注意事项】(1) 肾病、心脏病水肿、高血压患者慎用。(2) 一旦出现血栓性疾病，如血栓性静脉炎、脑血管病、肺栓塞、视网膜血栓形成的临床表现，应即停药。(3) 出现突发性部分视力丧失或突发性失明，复视或偏头痛，应立即停药。

【禁忌证】(1) 不明原因阴道出血患者。(2) 血栓性静脉炎、脑血管栓塞、脑卒中或有既往病史患者。(3) 乳腺肿瘤或生殖器肿瘤患者。

【不良反应】(1) 突破性出血，阴道点状出血，体重增加或减少，宫颈分泌物性状改变，乳房肿胀。(2) 恶心、头晕、头痛、倦怠感，发热，失眠。(3) 过敏伴或不伴瘙痒的皮疹，黑斑病，黄褐斑。(4) 阻塞性黄疸，肝功能异常。(5) 长期连续应用可月经减少或闭经。

【用法与用量】(1) 肌内注射：①先兆流产，一次10～20 mg，用至疼痛及出血停止。②习惯性流产史者，自妊娠开始，一次10～20 mg，每周2～3次。③功

能性子宫出血，用于撤退性出血血红蛋白低于7 mg时，一次10 mg，一日1次，连用5日；或一次20 mg，一日1次，连用3～4日。④闭经，在预计月经前8～10日，一日10 mg，共5日；或一日20 mg，连用3～4日。⑤经前期紧张综合征，在预计月经前12日开始注射，一次10～20 mg，一日1次，连用10日。(2) 口服：①先兆流产和习惯性流产、经前期紧张综合征、无排卵性功血和无排卵性闭经，一次100～150 mg，一日2次，空腹服。②更年期综合征，与雌激素（如结合雌激素)联合使用。结合雌激素，一次1.25 mg，一日1次，共22日；服用结合雌激素的第13日起服用本品，一次200 mg，一日2次，共10日。

【制剂与规格】黄体酮胶丸：100 mg。黄体酮胶囊：50 mg。
黄体酮注射液：1 ml : 20 mg。

孕三烯酮[保（乙）]

Gestrinone

【适应证】用于子宫内膜异位症。

【注意事项】(1) 开始治疗前必须排除妊娠的可能性，特别是以前有闭经的患者。整个治疗期间须采取屏障避孕措施(禁用口服避孕药)，一旦发现妊娠，应停止治疗。(2) 服药期间要定期检查肝功能，ALT及AST轻度升高者，服用保肝药可继续治疗，如ALT、AST明显升高且保肝药也无效时则应停止治疗。(3) 本品可引起体液潴留，故对心、肾功能不全者应密切观察。(4) 对高脂血症的患者应监测ALT及AST、胆固醇等水平，对有糖尿病的患者应监测血糖量水平。(5) 运动员慎用。

【禁忌证】严重心、肝、肾功能不全者，妊娠及哺乳期妇女。

【不良反应】少见头晕、头痛、乏力、胃肠功能紊乱、痤疮、多毛及脂溢性皮炎、腿肿、体重增加、乳房缩小松弛；可见月经周期缩短或延长、闭经、经量减少、不规则出血，但一般会自行减少；也可见转氨酶升高。

【用法与用量】口服：一次2.5 mg，一周2次。首次服药应在月经周期的第1日，在3日后服用第2次。在随后的治疗中必须在每周相同的2日（最好是在相同的时间）服用，治疗时间一般为6个月。如果漏服1次药物，应立即补服1次，然后保持原来的治疗顺序。如果漏服2次或以上，应停止治疗，然后在下次月经周期的第1日重新开始服药，但必须先做妊娠试验且为阴性，并按通常剂量方案服用。

【制剂与规格】孕三烯酮片：2.5 mg。
孕三烯酮胶囊：2.5 mg。

氯米芬[保（乙）]

Clomifene

【适应证】(1) 治疗无排卵的女性不孕症，适用于体内有一定雌激素水平者。(2)治疗黄体功能不足。(3)测试卵巢功能。(4) 探测男性下丘脑-垂体-性腺轴的功能异常。(5)治疗因精子过少的男性不育。

【注意事项】(1) 动物实验证明本品可致畸胎。在用药期间应每日测量基础体温，以监测患者的排卵与受孕，一旦受孕立即停药。(2) 多囊卵巢综合征慎用。(3) 用药期间按需进行下列测定：①促排卵激素（FSH）及促黄体生成激素（LH）；②长期用药者测定血浆内24-去氢胆固醇含量，查明用药对胆固醇合成有无影响；③血浆内的皮质激素传递蛋白含量；④血清甲状腺素含量；⑤性激素结合球蛋白含量；⑥磺溴酞钠（BSP）肝功能试验；⑦甲状腺素结合球蛋白含量（可能增多)。(4) 用药期间须注意检查：每个疗程开始前须正确估计卵巢大小；每日测量基础体温，必要时测定雌激素及血清孕酮水平；测尿内孕二醇含量，判断有无排卵；治疗前须测定肝功能，治疗1年以上者，须进行眼底及裂隙灯检查；用药中若出现视力障碍应立即停药并进行相应检查。

【禁忌证】原因不明的不规则阴道出血、子宫内膜异位症、子宫肌瘤、卵巢囊肿、肝功能损害、精神抑郁、血栓性静脉炎患者禁用。

【不良反应】(1) 常见肿胀、胃痛、盆腔或下腹部痛（囊肿形成或卵巢纤维瘤增大、较明显的卵巢增大，一般发生在停药后数日）。(2) 少见视物模糊、复视、眼前感到闪光、眼睛对光敏感、视力减退、

皮肤和巩膜黄染。(3) 下列反应持续存在时应予以注意：潮热、乳房不适、便秘或腹泻、头晕或晕眩、头痛、月经量增多或不规则出血、食欲和体重增加、毛发脱落、精神抑郁、精神紧张、好动、失眠、疲倦、恶心、呕吐、皮肤红疹、过敏性皮炎、风疹块、尿频等，也可有体重减轻。国外有极个别发生乳腺癌、睾丸癌的报告。

【用法与用量】口服：一次 50 mg，一日 1 次，连用 5 日。自月经周期的第 5 日开始服药。若患者系闭经，则应先用黄体酮撤退性出血的第 5 日始服用。患者在治疗后有排卵但未受孕可重复原治疗的疗程，直到受孕，或重复 3 ~ 4 个疗程。若患者在治疗后无排卵，在下一次的疗程中剂量可增加到一日 100 mg，共 5 日。个别患者药量可达一日 250 mg 时，才能排卵。

【制剂与规格】枸橼酸氯米芬片：50 mg。

枸橼酸氯米芬胶囊：50 mg。

甲睾酮[基(基). 保(甲)]

Methyltestosterone

【适应证】(1) 原发性或继发性男性性功能低减。(2) 绝经期后女性晚期乳腺癌的姑息性治疗。

【注意事项】(1) 心、肝、肾功能不良者，前列腺肥大、高血压患者慎用。(2) 运动员慎用。

【禁忌证】孕妇、前列腺癌患者。

【不良反应】(1) 长期大剂量应用易致胆汁淤积性肝炎，出现黄疸、肝功能异常。舌下给药可致口腔炎，表现为疼痛、流涎等症状。(2) 女性可能引起痤疮、多毛、声音变粗、闭经、月经紊乱，应立即停药。(3) 男性睾丸萎缩、精子生成减少、精液减少，应停药。(4) 电解质水钠潴留。

【用法与用量】口服或舌下含服：①男性性腺功能低下者激素替代治疗，一次 5 mg，一日 2 次。②绝经妇女晚期乳腺癌姑息性治疗，一次 25 mg，一日 1 ~ 4 次；如果治疗有反应，2 ~ 4 周后可减至一日 2 次，一次 25 mg。

【制剂与规格】甲睾酮片：5 mg。

丙酸睾酮[基(基). 保(甲)]

Testosterone Propionate

【适应证】(1) 原发性或继发性男性性功能减低。(2) 男性青春期发育迟缓。(3) 绝经期后女性晚期乳腺癌的姑息性治疗。

【注意事项】(1) 用于乳腺癌治疗时，治疗 3 个月内应有效果，若病情发展，应立即停药。(2) 一般不与其他睾酮制剂换用，因它们的作用时间不同。(3) 男性应定期检查前列腺。(4) 运动员慎用。

【禁忌证】肝肾功能不全、孕妇及前列腺癌患者。

【不良反应】(1) 注射部位可出现疼痛、硬结、感染及荨麻疹。(2) 大剂量可致女性男性化，男性睾丸萎缩、精子减少。(3) 水肿、黄疸、肝功能异常。(4) 皮疹。

【用法与用量】深部肌内注射：(1) 成人常用量：①男性性腺功能低下激素替代治疗，一次 25 ~ 50 mg，一周 2 ~ 3 次。②绝经后女性晚期乳腺癌，一次 50 ~ 100 mg，一周 3 次。③功能性子宫出血，配合黄体酮使用，一次 25 ~ 50 mg，一日 1 次，共 3 ~ 4 次。(2) 儿童常用量：用于男性青春发育延缓，一次 12.5 ~ 25 mg，一周 2 ~ 3 次，疗程不超过 4 ~ 6 个月。

【制剂与规格】丙酸睾酮注射液：① 1 ml : 10 mg；② 1 ml : 25 mg；③ 1 ml : 50 mg。

达那唑[保(乙)]

Danazol

【适应证】(1) 子宫内膜异位症。(2) 纤维囊性乳腺病、自发性血小板减少性紫癜、遗传性血管性水肿、系统性红斑狼疮、男子女性乳房、青春期性早熟。

【注意事项】(1) 癫痫、偏头痛、糖尿病患者慎用。(2) 治疗期间注意肝功能检查。(3) 男性用药时，需检查精液量、黏度、精子数和活动力，每 3 ~ 4 个月检查 1 次，特别是青年患者。(4) 女性开始治疗时，应采取避孕工具，防止妊娠；一旦发生妊娠，立即停药并终止妊娠。(5) 服药期间，对一些诊断性试验有影响，

如糖耐量试验、甲状腺功能试验、血清总 T_4 可降低而血清 T_3 则可增加。(6) 出现女性男性化症状，应停止治疗。

【禁忌证】血栓症，心、肝、肾功能不全，异常生殖器出血患者。

【不良反应】(1) 常见闭经，突破性子宫出血，并可有乳房缩小、音哑、毛发增多；可出现痤疮、皮肤或毛发的油脂增多、下肢水肿或体重增加，症状与药量有关，是雄激素效应的表现。(2)少见血尿、鼻出血、齿龈出血、白内障(视力逐渐模糊)、肝功能异常、颅内压增高（表现为严重头痛、视力减退、复视、呕吐)、白细胞增多症、急性胰腺炎、多发性神经炎等。(3) 罕见女性阴蒂增大、男性睾丸缩小；肝功能损害严重时，男女均可出现巩膜或皮肤黄染。(4) 以下反应如果持续出现需引起注意：①由于雌激素效能低下，可使妇女有阴道灼热、干枯及瘙痒，或阴道出血。②可出现皮肤发红、情绪或精神状态的改变、神经质或多汗。③有时可出现肌痉挛性疼痛，属于肌肉中毒症状。

【用法与用量】(1) 口服：①子宫内膜异位症，一日量 400 ~ 800 mg，分次服用，连服 3 ~ 6 个月，如停药后症状再出现，可再给药 1 个疗程（在肝功能正常情况下)。②纤维囊性乳腺病，于月经开始后第 1 日服药，一次 50 ~ 200 mg，一日 2 次，如停药后 1 年内症状复发，可再给药。③遗传性血管性水肿，开始一次 200 mg，一日 2 ~ 3 次，直到疗效出现，维持量一般是开始量的 50% 或更少，在 1 ~ 3 个月或更长一段的间隔时间递减，根据治疗前发病的频率而定。(2) 阴道给药：栓剂，用于痛经症状明显，但体征较轻的子宫内膜异位症，一次 50 mg（1 枚)，一日 1 ~ 2 次，月经期停用 3 ~ 4 日，3 ~ 6 个月为 1 个疗程。

【制剂与规格】达那唑胶囊：①100 mg；② 200 mg。

达那唑胶丸：10 mg。

达那唑栓：50 mg。

尿促性素[保(乙)]

Menotrophin

【适应证】与绒促性素合用，用于促性腺激素分泌不足所致的原发性或继发性闭经、无排卵性月经稀发所致的不孕症等。

【注意事项】(1) 在有经验的妇科内分泌科医师指导下用药。用药期间应注意监测：①全面进行盆腔检查，以了解卵巢大小，特别从雌激素浓度上升后，至加用绒促性素至少 2 周；②每日测量基础体温，有助于了解卵巢排卵；③雌激素排泄测定，以用本品 1 周后，每日留尿或抽血测雌激素，仅在雌激素高峰后 24 小时开始用绒促性素，如雌激素值过高，不宜给大剂量人绒毛膜促性腺激素（HCG)，以免引起卵巢过度刺激；④宫颈黏液检查有助于了解卵泡成熟程度或有否排卵；⑤查 β-HCG 检测早孕；⑥对促黄体生成素（LH）值高的患者，如多囊卵巢综合征，应使用仅含促卵泡成熟激素（FSH）75U 的促性腺激素。(2) 哮喘、心脏病、癫痫、肾功能不全、垂体肿瘤或肥大、甲状腺或肾上腺皮质功能减退患者慎用。(3) 运动员慎用。(4) 如出现重度卵巢过度刺激综合征，应立即停药。(5) 使用本品与绒促性素合并治疗后的妊娠有产生死胎、先天性畸形的报道，但是未证明与本品有直接关系。(6) 在使用本品治疗中，以超声波检查卵泡成熟时卵泡直径达 20 mm 以上时，雌激素含量 24 小时达 100 ~ 150 μg，可注射绒促性素，如超过以上指标者，出现卵巢过度刺激症状，应当停药。

【禁忌证】有原因不明的异常阴道出血、子宫肌瘤、卵巢囊肿、卵巢增大、肾上腺功能不全、甲状腺功能不全及原发性卵巢功能衰竭患者。

【不良反应】(1) 主要为卵巢过度刺激综合征，表现为下腹不适或胀感、腹痛、恶心、呕吐、卵巢增大，严重者可致胸闷、气急、尿量减少、胸腔积液、腹水甚至卵泡囊肿破裂出血等。(2) 多胎妊娠和早产。

【用法与用量】肌内注射：临用前，将本品一次用量用氯化钠注射液 1 ~ 2 ml 溶解后使用。初始（或月经周期第 5 日）用量，一次 75 U，一日 1 次，7 日后视患者雌激素水平和卵泡发育情况调整剂量。若卵巢无反应，则自第 2 周起每隔 7 日增加 75 U，但一次剂量最多不超过 225 U。卵泡成熟后改用肌内注射绒促性

素（HCG）10 000 U，诱导排卵。对注射3周后卵巢无反应者，则停止用药。

【制剂与规格】注射用尿促性素：① 75 U；② 150 U。

绒促性素[基（基）、保（甲）]

Chorionic Gonadotrophin

【适应证】(1) 青春期前隐睾症的诊断和治疗。(2) 垂体功能低下所致的男性不育，可与尿促性素合用。长期促性腺激素功能低下者，还应辅以睾酮治疗。(3) 垂体促性腺激素不足所致的女性无排卵性不孕症，常在氯米芬治疗无效后，联合应用本品与绝经后促性腺激素合用以促进排卵。(4) 用于体外受精以获取多个卵母细胞，需与绝经后促性腺激素联合应用。(5) 女性黄体功能不全的治疗。(6) 功能性子宫出血、妊娠早期先兆流产、习惯性流产。

【注意事项】(1) 前列腺肥大、哮喘、癫痫、心脏病、偏头痛、肾功能损害、高血压患者慎用。(2) 运动员慎用。(3) 发现卵巢过度刺激综合征及卵巢肿大，胸腔积液、腹水等并发症时应停药。(4) 使用前应向患者说明有多胎妊娠的可能性。使用中询问不良反应和定期进行有关的临床检查。(5) 对妊娠试验可出现伪阳性，应在用药后10日后进行检查。

【禁忌证】(1) 怀疑有垂体增生或肿瘤，前列腺癌或其他与雄激素有关的肿瘤患者。(2) 性早熟者、诊断未明的阴道出血、子宫肌瘤、卵巢囊肿或卵巢肿大、血栓性静脉炎、对性腺刺激激素有过敏史者。

【不良反应】(1) 用于促排卵时，多见诱发卵巢囊肿或轻到中度的卵巢肿大，伴轻度胃胀、胃痛、盆腔痛，一般可在2～3周消退，少见者为严重的卵巢过度刺激综合征。(2) 腹部或盆腔部剧烈疼痛、消化不良、水肿、尿量减少、恶心、呕吐或腹泻，气促、下肢肿胀等。往往发生在排卵后7～10日或治疗结束后，反应严重可危及生命。(3) 用于治疗隐睾症时偶可发生男性性早熟，表现为痤疮、阴茎和睾丸增大、阴毛生长增多、身高生长过快。(4) 乳房肿大、头痛、易激动、精神抑郁、易疲劳。(5) 偶见注射局部疼痛、过敏性皮疹。(6) 用本品促排卵可增加多胎率或新生儿发育不成熟、早产等。

【用法与用量】肌内注射：(1) 成人常用量：①男性促性腺激素功能不足所致性腺功能低下，一次1 000～4 000 U，一周2～3次，持续数周至数月。为促发精子生成，治疗需持续6个月或更长，若精子数少于500万/ml，应联合应用尿促性素12个月左右。②促排卵，为女性无排卵性不孕或体外受精，于尿促性素末次给药后1日或氯米芬末次给药后5～7日，一次5 000～10 000 U，连续治疗3～6周期，如无效应停药。③黄体功能不全，于经期15～17日排卵之日起隔日用药1次，一次1 500 U，连用5次，可根据患者的反应做调整。妊娠后，须维持原剂量直至7～10孕周。④功能性子宫出血，一次1 000～3 000 U。⑤习惯性流产、先兆流产，一次1 000～5 000 U。(2) 小儿常用量：①发育性迟缓者睾丸功能测定，一次2 000 U，一日1次，连用3日。②青春期前隐睾症，一次1 000～5 000 U，一周2～3次，出现良好效应后即停用，总注射次数不多于10次。

【制剂与规格】注射用绒促性素：① 1000 U；② 2 000 U；③ 5 000 U。

曲普瑞林[保（乙）]

Triptorelin

【适应证】(1) 男性转移性前列腺癌。(2) 儿童真性性早熟。(3) 女性子宫内膜异位症。(4) 不孕症：在体外受精-胚胎移植程序(IVF-ET)中通常与其他激素(如促性腺激素)联合使用。

【注意事项】(1) 男性前列腺癌治疗开始时，极少数病例有单发的一过性的临床症状加重（尤其是骨痛）。治疗初期可观察到酸性磷酸酶一过性增高。有必要定期检查血睾酮水平，不应高于1 ng/ml。(2) 女性在治疗前应确认没有妊娠。该药不应在哺乳期使用。(3) 女性不孕症，对于一些敏感的患者，尤其多囊卵巢疾病的患者，当联合使用促性腺激素时，注射曲普瑞林引起卵泡增多。诱导排卵应在严格的、定期的生物检测和临床检查下进行：血浆雌激素快速定量和超声检查。当卵巢

反应过度时，建议停止注射促性腺激素，以终止刺激周期。(4) 子宫内膜异位症和手术前子宫肌瘤的治疗，每4周定期使用1支，通常引起低促性腺素性闭经。1个月治疗后子宫出血属于异常；应核实血浆雌二醇水平，如果低于50 pg/ml，需检查可能伴有的器质性病变。(5) 停止治疗后，卵巢功能恢复，最后1次注射后平均58日出现排卵，平均70日后出现第1次月经。应注意在最后1次注射的1.5个月之后采取避孕措施。

【禁忌证】对促性腺激素释放激素(GnRH)，GnRH类似物或药品任何一种成分过敏者。

【不良反应】(1) 男性：治疗初期部分患者可见尿路症状、前列腺癌、骨转移造成骨痛、椎骨转移造成的脊髓压迫等症状加重，1～2周后这些症状会消失；治疗过程中最常见的不良反应包括潮热、性欲下降和阳痿等。(2) 女性：治疗初期可见子宫内膜异位症症状（骨盆疼痛，痛经）加重，1～2周后消失。第一次注射后1个月内可能出现子宫出血。该药物用于治疗女性不孕症时，联合使用促性腺激素可造成对卵巢刺激，有可能出现卵巢肥大，盆腔疼痛和（或）腹痛。治疗过程中最常见的不良反应包括潮热、阴道干燥、性欲下降、性交困难等；罕见头痛、关节痛和肌肉痛。(3) 男、女性：过敏反应，如荨麻疹、皮疹、瘙痒；罕见Quincke水肿（昆克水肿）、恶心、呕吐、体重增加、高血压、情绪紊乱、发热、视觉异常、注射处疼痛；长期使用GnRH类似物可引起骨质流失，有致骨质疏松的危险。(4) 儿童：可能导致女孩出现少量阴道出血；过敏反应，如荨麻疹、皮疹、瘙痒；罕见Quincke水肿；一些患儿出现恶心、呕吐、体重增加、高血压、情绪紊乱、发热、视觉异常、注射部位疼痛。

【用法与用量】肌内注射：①前列腺癌，一次3.75 mg，每4周1次。②性早熟，按体重一次50μg/kg，每4周1次。③子宫内膜异位症，月经周期的第1～5日开始治疗，一次3.75 mg，每4周1次。原则上，1个疗程应至少4个月，至多6个月。④女性不孕症，一次3.75 mg，月经周期第2日使用。在使垂体脱敏后（血浆雌激素 <50 pg/ml），一般在注射本品后15日，开始联合使用促性腺激素治疗。⑤手术前子宫肌瘤的治疗，治疗应在月经周期的前5日开始，一次3.75 mg，每4周1次，疗程3个月。

【制剂与规格】醋酸曲普瑞林注射液：1 ml : 0.1mg（以曲普瑞林计）。

注射用醋酸曲普瑞林：0.1 mg（以曲普瑞林计）。

注射用曲普瑞林：3.75 mg。

亮丙瑞林[保(乙)]

Leuprorelin

【适应证】(1)子宫内膜异位症。(2)对伴有月经过多、下腹痛、腰痛及贫血等的子宫肌瘤，可使肌瘤缩小和(或)症状改善。(3) 绝经前乳腺癌，且雌激素受体阳性患者。(4) 前列腺癌。(5) 中枢性性早熟症。

【注意事项】(1) 已存在由脊髓压迫或尿潴留引起的肾功能损害者或者是有重新发作可能性的患者慎用。(2) 女性在治疗前应确认没有妊娠，且于月经周期的第1～5日开始用药，并在治疗期间应采用非激素性方法避孕。(3) 哺乳期妇女不应给予。(4) 下列情况慎用：对含有明胶的药物或含有明胶的食物有过敏史者，例如休克、过敏性症状（荨麻疹、呼吸困难、口唇水肿、喉头水肿等）。(5) 对早产儿、新生儿和婴儿的安全性尚未确定。(6) 老年人和高龄者慎用。(7) 首次用药初期，由于高活性LH-RH衍生物对垂体－性腺系统的刺激作用，使血清睾丸素浓度上升，可见骨性疼痛暂时加重、尿潴留或脊髓压迫症状，应对症处理。(8) 给药时应注意与类似疾患（恶性肿瘤等）鉴别，如给药过程中肿瘤增大，临床症状未见改善时应中止给药。(9) 由于雌激素降低可引起骨质的损失，故需长期给药或再次给药时，应尽可能检查骨密度，慎重用药。

【禁忌证】(1) 对本品所含成分以及合成的促黄体生成释放激素或促黄体生成释放激素衍生物有过敏史者。(2) 孕妇或有可能妊娠的妇女、哺乳期妇女。(3) 有性质不明的、异常的阴道出血患者。

【不良反应】(1) 内分泌系统：发热、面部潮红、出汗、性欲减退、阳痿、男子女性化乳房、睾丸萎缩、会阴部不适等现象。(2) 肌肉骨骼系统：可见骨疼痛、肩腰四肢疼痛。(3) 泌尿系统：可见排尿障碍、血尿等。(4) 循环系统：可见心电图异常、心胸比例增大等。(5) 消化系统：恶心、呕吐、食欲缺乏等。(6) 过敏反应：可见皮疹瘙痒等。注射局部疼痛、硬结、发红。(7) 其他：可见水肿、胸部压迫感、发冷、疲倦、体重增加、感觉异常、听力衰退、耳鸣、头部多毛，血尿酸、血尿素氮、乳酸脱氢酶、ALT 及 AST 等升高；由于雌激素降低作用而出现的更年期综合征样的精神抑郁状态；已有因使用本品引起血栓形成及肺栓塞的报告。

【用法与用量】皮下注射：①子宫内膜异位症，成人一次 3.75 mg，每 4 周 1 次；当患者体重低于 50 kg 时，一次 1.88 mg，每 4 周 1 次。初次给药应从月经周期的第 1 ~ 5 日开始。②子宫肌瘤，成人一次 1.88 mg，每 4 周 1 次。对体重过大或子宫明显肿大的患者，一次 3.75 mg，每 4 周 1 次。初次给药应从月经周期的第 1 ~ 5 日开始。③前列腺癌、闭经前乳腺癌，成人一次 3.75 mg，每 4 周 1 次。④中枢性性早熟症，儿童按体重一次 30μg/kg，根据症状可增量至一次 90μg/kg，每 4 周 1 次。

【制剂与规格】注射用醋酸亮丙瑞林：3.75 mg。

注射用醋酸亮丙瑞林微球：1.88 mg。

戈舍瑞林 [保（乙）]

Goserelin

【适应证】(1) 前列腺癌。本品适用于可用激素治疗的前列腺癌。(2) 乳腺癌。适用于可用激素治疗的绝经前期及围绝经期妇女的乳腺癌。(3) 子宫内膜异位症。缓解症状，包括减轻疼痛并减少子宫内膜损伤。

【注意事项】(1) 对有发展为输尿管梗阻或脊髓压迫危险的男性患者慎用。(2)女性使用本品可能引起骨矿物质丢失。本品用于治疗子宫内膜异位症时，加入激素替代疗法可以减少骨矿物质丢失和血管舒缩症状。对已知有骨代谢异常的女性患者应注意。(3) 使用本品可能会引起子宫颈阻力增加，导致扩张子宫颈较困难。

【禁忌证】(1) 对本品所含成分以及合成的促黄体生成释放激素或促黄体生成释放激素衍生物有过敏史者。(2) 孕妇及哺乳期妇女。(3) 儿童。

【不良反应】(1) 一般反应：过敏反应、关节痛、皮疹、低血压或高血压、注射部位有轻度淤血。(2) 男性：包括潮红、多汗、性欲下降、乳房肿胀和触痛、骨骼疼痛暂时性加重、尿管梗阻和脊髓压迫、骨矿物质丢失。(3) 女性：包括面部潮红、多汗、性欲下降、头痛、情绪变化如抑郁、阴道干燥及乳房大小的变化、阴道出血。(4) 治疗初期乳腺癌的患者会有症状的加剧，应对症处理。对于有子宫肌瘤的妇女，肌瘤可能会变性。(5)伴有骨转移的乳腺癌患者在治疗初期可发生高钙血症。(6) 极少数妇女在用本品治疗期间进入绝经期，停止治疗后月经不恢复。(7) 出现卵泡和黄体卵巢囊肿，多数囊肿为无症状的、非功能性的，其大小不同且可自行消除。

【用法与用量】腹前壁皮下注射：一次 3.6 mg，每 28 日 1 次。对肾或肝功能不全患者及老年患者不需调整剂量。

【制剂与规格】醋酸戈舍瑞林缓释植入剂：3.6 mg（以戈舍瑞林计）。

戈那瑞林 [保（乙）]

Gonadorelin

【适应证】(1) 用于垂体兴奋试验，以鉴别诊断生育障碍病因（下丘脑性或垂体性）：如性腺萎缩导致的性腺功能不足、乳溢性闭经，原发性和继发性闭经、绝经和早熟绝经，垂体肿瘤等。(2) 下丘脑异常所致的无排卵性不孕，或男性生精异常所致不育。(3) 下丘脑病变所致的青春期发育迟缓。(4) 激素依赖型前列腺癌和乳腺癌、子宫内膜异位症。

【注意事项】(1) 垂体兴奋试验，女性进行此试验时宜选择在卵泡期及早给药。(2) 以本品作垂体兴奋试验时，由于肾上腺糖皮质激素、性激素（雌激素、雄激素、孕激素或口服避孕药）、螺内酯、左旋多巴、地高辛、吩噻嗪以及能够升高

催乳素水平的多巴胺拮抗药，可通过对垂体的负反馈作用而影响试验结果，故不能同时使用该类药物。(3) 在用药期间，本品对垂体 - 性腺起兴奋作用，继续用药则起抑制作用，因此在开始几周常加用雄激素拮抗药环丙孕酮（Cyproterone）以对抗用药早期睾酮浓度的增高。(4) 闭经合并肥胖者，应在体重减轻后再行治疗。(5) 在治疗前列腺癌等肿瘤的第一周内，可出现病情加重，表现为骨痛加剧、血尿、尿道阻塞加重、下肢软弱无力或感觉异常；对有脑转移的患者，该反应更为严重；为了防止肿瘤症状加剧，可加用氟他胺或醋酸环丙孕酮。(6) 本品避免与其他可刺激排卵的药物（如尿促性素）或其他促性腺激素释放激素、脑垂体激素同时使用。

【禁忌证】①对本品过敏者；②对苯甲醇过敏者（本品注射液可能含苯甲醇）；③多囊卵巢、无睾丸、无卵巢者；④妊娠妇女。

【不良反应】(1) 消化系统：少见胃肠道反应，如恶心、腹痛或腹部不适。(2) 神经系统：头痛、头晕目眩、失眠，但不常发生。(3) 泌尿生殖系统：可引起多囊卵泡形成及多胎妊娠；偶有暂时性阴茎肥大、精子生成受抑制、阳痿；月经过多、阴道干燥、性欲减退、黄体解体、卵巢迅速肥大；血尿或尿塞感等。(4)代谢 / 内分泌系统：可出现骨质疏松。(5) 局部反应：注射部位疼痛、肿胀、瘙痒、血栓性静脉炎以及局部血肿、感染等。(6) 变态反应：可发生全身或局部过敏，如支气管痉挛、皮疹、荨麻疹、面部潮红、瘙痒等。(7) 其他：下肢无力、感觉异常，罕见睾丸萎缩、男性乳房发育。

【用法与用量】(1) 静脉注射：①垂体兴奋试验：临用前将本品注射剂用氯化钠注射液 2 ml 溶解，女性一次 25 μg、男性一次 100 μg，静脉注射，分别于注射前、注射后 25 分钟、45 分钟、90 分钟、180 分钟时各抽血 3 ml，取血清保存，进行放射免疫测定 LH 及 FSH，从而进行鉴别诊断。正常情况下，注射 25 ~ 45 分钟时，LH 达峰值，为基值的 3 倍以上，FSH 峰值出现较迟，为基值的 2 倍以上。有垂体疾病时反应较低。下丘脑异常时反应正常或高亢。②下丘脑异常所致无排卵女性不孕：使用定时自动注射泵，于月经周期的第 2 ~ 4 日，每隔 90 ~ 120 分钟注入 5 ~ 15 μg（1 分钟内给完），昼夜不停，连续使用 14 日。治疗期间，需检测卵泡发育情况，以便确定排卵时机，排卵后 2 日可改用肌内注射人绒促性素(HCG) 1 000 U，一周 2 次，共 3 ~ 4 次以支持黄体功能。③男性生精异常所致不育：使用定时自动注射泵，每隔 90 ~ 120 分钟注入 5 ~ 15 μg，昼夜不停，连续使用至少 14 日。(2) 皮下注射：治疗前列腺癌，开始 7 日，一次 0.5 mg，一日 1 次，以后一日 1 次，一次 0.1 mg。(3) 静脉滴注：治疗不孕，于月经周期第 2 ~ 4 日，一次按每分钟 2 ~ 20 μg 的速度，共给药 90 分钟。如无排卵（测基础体温），可重新给药。排卵后肌内注射人绒促性素 1 500 U，3 日后再注射 1 500 U，一般 2 ~ 4 个周期后可受孕。

【制剂与规格】戈那瑞林注射液：(1) 1 ml ∶ 100 μg；(2) 1 ml ∶ 500 μg。

注射用戈那瑞林：(1) 50 μg；(2) 100 μg；(3) 200 μg；(4) 500 μg。

阿拉瑞林（丙氨瑞林）[保(乙)]

Alarelin

【适应证】用于治疗子宫内膜异位症。

【注意事项】(1) 撤药时除因子宫内膜异位症引起的不孕症患者可采用突然停药外，其余患者均需采用逐步撤药的方法。(2) 如用药期间出现淋漓出血，应咨询医生调整剂量，剂量可调至一日 200 μg，皮下注射或肌内注射。(3) 用药期间应采取有效的避孕措施（但禁用甾体激素避孕药）。(4) 如疗程超过 6 个月以上应注意可能发生骨质丢失。(5) 对于以往曾使用过本品或其他 LHRH 类似物治疗患者、有长期饮酒或吸烟史等患者，有骨质疏松症家族史者或长期服用可导致骨质丢失药物（例如皮质激素或抗惊厥药物）患者，若需使用本品应权衡利弊。(6) 对于有抑郁症的患者，使用本品应密切注意情绪的变化。(7) 出现全身性皮疹应立即停药。(8) 老年、儿童慎用。

【禁忌证】妊娠、哺乳期妇女及原因

不明阴道出血者禁用；对本品或类似物过敏者禁用。

【不良反应】可出现因低雌激素状态引起的症状，如潮热、阴道干燥、性欲改变、情绪改变，体重变化、乳房缩小或胀痛、色素沉着，以及口干、头晕、乏力、胸闷、恶心、皮疹、注射部位硬结等，停药后症状消失。

【用法与用量】皮下或肌内注射，月经来潮的第 1 ~ 2 日开始治疗，一次 150 μg，一日 1 次，或遵医嘱。制剂在临用前用 2 ml 氯化钠注射液溶解。3 ~ 6 个月为 1 个疗程。

【制剂与规格】注射用阿拉瑞林：① 25 μg；② 150 μg。

甲磺酸溴隐亭[保(乙)] 用于：①月经不调及女性不孕症：由泌乳素引起的泌乳素过高或正常情况下的闭经、月经过少，黄体期过短，由药物引起的高泌乳素血症；与泌乳素无关的女性不孕症，如多囊卵巢综合征、无排卵周期（与抗雌激素合用，如克罗米酚）。②抑制泌乳：因医疗所需预防或抑制产后泌乳，预防流产后泌乳，产后初期乳腺炎。口服：①月经不调及女性不孕症，初始一次 1.25 mg，一日 2 ~ 3 次，如效果不显著，可逐渐增至一次 2.5 mg，一日 2 ~ 3 次，饭后服用。连续治疗至月经周期恢复正常，以及（或）恢复排卵。如有需要，可连续治疗几个月经周期，以防止复发。②抑制泌乳，一次 2.5 mg，一日 2 次，早晚与食物共服，连续用药 14 日。分娩或流产后早期服用。停药后，偶有少量的乳液分泌 2 ~ 3 日，以同样剂量继续服用数日后就可停止。

12.8 妇科恶性肿瘤的化疗用药

在妇科恶性肿瘤中，化疗是卵巢癌手术前后主要辅助治疗，是妊娠滋养细胞肿瘤的主要治疗，也是各种晚期复发性妇科恶性肿瘤的治疗方法。多采用联合药物方案治疗。

下述具体药物见第 10 章 肿瘤用药。

（1）卵巢上皮癌、子宫内膜癌及各种晚期复发性妇科恶性肿瘤常用联合化疗方案：①紫杉醇 135 ~ 175 mg/m^2，卡铂，根据卡铂药 - 时曲线下面积（AUC）= 5 计算。以静脉化疗为主，晚期癌可行静脉与腹腔化疗。②环磷酰胺 500 ~ 700 mg/m^2，阿霉素 30 ~ 50 mg/m^2，顺铂 50 ~ 75 mg/m^2。③环磷酰胺、顺铂，每种药物剂量同前，均以一日给药为 1 个疗程。每间隔 3 周 1 个疗程，共 3 ~ 8 个疗程，根据患者病情及不良反应决定化疗剂量与疗程。用药注意事项：应用顺铂化疗者，均须在化疗前一日晚水化，保护肾功能，用 5% 葡萄糖氯化钠注射液 2 000 ml，静脉滴注，当日给甘露醇、呋塞米、地塞米松一次 10 mg，止吐药物如 5-HT$_3$ 拮抗药如昂丹司琼、托烷司琼等；应用紫杉醇化疗前一日晚，采用脱敏疗法，给地塞米松 20 ~ 40 mg，分 2 次口服。

（2）卵巢生殖细胞肿瘤常用联合化疗方案：①博来霉素 18 ~ 20 mg/m^2，第 2 日给药；每周重复一次，连续 12 周。长春新碱 1 ~ 1.5 mg/m^2 第 1、2 日给药；顺铂一日 20 mg/m^2，第 1 ~ 5 日给药，5 日为 1 个疗程；间隔 3 周。不良反应为博来霉素可使肺纤维化，终身剂量小于 300 mg。②博来霉素 15 mg/m^2，第 1、2 日给药，依托泊苷 100 mg/m^2 和顺铂 30 mg/m^2，第 1、2、3 日给药。

（3）妊娠滋养细胞肿瘤常用联合化疗方案：①氟尿嘧啶 + 放线菌素 D 方案：氟尿嘧啶按体重一日 24 ~ 26 mg/kg + 5% 葡萄糖注射液 500 ml，8 小时内静脉滴注；放线菌素 D 按体重一日 4 ~ 6μg/kg + 5% 葡萄糖注射液 250 ml，1 小时内静脉滴注，共 6 ~ 8 日；每个疗程间隔 3 周。②依托泊苷一日 100 mg/m^2 + 氯化钠注射液 400 ml，1 小时内静脉滴注；放线菌素 D 500μg（按体重一日 10 ~ 13 μg/kg）+ 5% 葡萄糖注射液 250 ml，静脉滴注，共 5 日，每个疗程间隔 3 周。③博来霉素 15 mg/m^2，第 1、2 日给药，依托泊苷 100 mg/m^2 和顺铂 30 mg/m^2，第 1、2、3 日给药。④ EMA-CO 方案（放线菌素 D、依托泊苷、甲氨蝶呤 - 长春新碱、环磷酰胺），请参阅《临床诊疗指南》（肿瘤分册）。停药指征：一般认为，化疗应持续到症状体征消失、原发和转移灶消失，

HCG 每周测定 1 次，连续 3 次正常，再巩固数个疗程方可停药，无转移和低危转移的病例，巩固疗程宜少。

（4）恶性肿瘤的激素治疗：用于子宫内膜癌不宜手术、放疗者，以及晚期或复发患者；年轻、早期、要求保留生育功能者，可慎重应用；用药时间无统一，至少应用 12 周以上。孕激素治疗：①醋酸甲羟孕酮，口服，一日 100 ~ 200 mg，6 ~ 12 个月以上。主要不良反应为水钠潴留、体重增加及栓塞危险等。②醋酸甲地孕酮，口服，一日 80 ~ 160 mg。③氯地孕酮，口服，一日 20 ~ 40 mg。

12.9 计划生育用药

12.9.1 女性甾体激素避孕药

甾体激素（hormonal contraception）避孕药大致可以分为 4 类：睾酮衍生物、孕酮衍生物、雌激素衍生物和螺内酯类。甾体激素避孕药临床应用种类为口服避孕药、注射避孕针、缓释系统避孕药和避孕贴剂。

12.9.1.1 口服避孕药

（1）短效口服避孕药：①单相片。整个周期中雌、孕激素剂量固定。种类有复方炔诺酮片、复方甲地孕酮片、复方左旋炔诺酮片、去氧孕烯炔雌醇、复方孕二烯酮 、复方环丙孕酮片。②三相片。模仿正常月经周期中内源性雌、孕激素水平变化 3 个阶段中雌孕激素剂量均不同，顺序服用。前 6 片含低剂量的雌、孕激素，中间 5 片两种激素含量均高，后 10 片孕激素含量高而雌激素含量低。左旋炔诺孕酮三相片：按顺序服用。首次服药在月经第 1 日，有效片连服 21 日，停药 7 日后开始服用下一个周期用药。

（2）长效口服避孕药：复方炔诺孕酮二号片、复方炔雌醚片、三合一炔雌醚片。

（3）探亲避孕药：炔诺孕酮探亲避孕片、甲地孕酮探亲避孕片、53 号抗孕片。

12.9.1.2 注射避孕药

（1）单纯孕激素类（醋酸甲羟孕酮避孕针）。

（2）雌、孕激素混合类（复方己酸孕酮、复方甲地孕酮避孕针）。

12.9.1.3 缓释系统避孕药

①皮下埋植剂：含有左炔诺孕酮的硅胶棒植入皮下，于月经第 7 日在上臂内侧植入，可以避孕 5 年。②缓释阴道避孕环（contraception vaginal ring，CVR）：甲硅环，含甲地孕酮 250 mg，可以使用 1 年；使用者可以自己放入和取出。③微球和微囊避孕：庚炔诺酮微球针、复方甲地孕酮微囊，每月注射 1 次。

12.9.1.4 避孕贴剂

月经第 1 日使用，每周 1 片，连续 3 周，停用 1 周。

炔雌醇[保（乙）]

Ethinylestradiol

【适应证】（1）补充雌激素不足，治疗女性性腺功能不良、闭经、更年期综合征等。（2）用于晚期乳腺癌（绝经期后妇女）、晚期前列腺癌的治疗。（3）与孕激素类药合用，能抑制排卵，可作避孕药。

【注意事项】（1）肝、肾、心脏病患者，子宫肌瘤、癫痫、糖尿病患者慎用。（2）不明原因的阴道出血者不宜使用。（3）孕妇及哺乳期妇女用药不宜使用。（4）青春期前儿童慎用，以免早熟及骨骼早期闭合。（5）老年患者用药适当减量。

【禁忌证】与雌激素有关的肿瘤，如乳腺癌、子宫颈癌禁用（前列腺癌、绝经期后乳腺癌除外），血栓性静脉炎、肺栓塞患者禁用。

【不良反应】（1）可有恶心、呕吐、头痛、乳房胀痛、腹胀等。（2）偶有阴道不规则流血、闭经、尿频、尿痛、头痛、血压升高、皮疹、乳腺小肿块等。

【用法与用量】口服：①性腺发育不全，一次 20 ~ 50 μg，每晚 1 次，连服 3 周，第三周配用孕激素进行人工周期治疗，可用 1 ~ 3 个周期。②更年期综合征，一日 20 ~ 50 μg，连服 21 日，间隔 7 日再用，有子宫的妇女，于周期后期服用孕激素 10 ~ 14 日。③乳腺癌，一次 1 mg，一日 3 次。④前列腺癌，一次 50 ~ 500 μg，

一日 3 ~ 6 次。

【制剂与规格】炔雌醇片：① 5 μg；② 20 μg；③ 50 μg；④ 500 μg。

复方炔诺酮片（膜）

Compound Norethisterone Tablets (Pellicles)

【适应证】用于女性避孕。

【注意事项】(1) 口服片剂：①服用本品时应当每年进行体检，在体检过程中向医师说明正在服用本品。②出现下列症状时应停药，怀疑妊娠、血栓栓塞病、视觉障碍、高血压、肝功能异常、精神抑郁、缺血性心脏病等。③按规定方法服药，漏服药不仅可发生突破性出血，还可导致避孕失败。一旦发生漏服，除按常规服药外，应在 24 小时内加服 1 片。④哺乳期妇女应于产后半年开始服用。(2) 外用膜剂：①取用药膜时，应注意药膜与包装纸的区别，切勿错用。②药膜必须置于阴道深处，待溶解后（约 10 分钟）方可进行房事。③房事后 6 小时方可冲洗。

【禁忌证】(1) 乳腺癌、生殖器官癌、肝功能不全、近期有肝病及黄疸史、深部静脉血栓、脑血管意外、高血压、心血管病、糖尿病、高脂血症、精神抑郁症患者禁用。(2) 40 岁以上妇女禁用。

【不良反应】(1) 口服片剂：①类早孕反应，表现为恶心、呕吐、困倦、头晕、食欲缺乏。②突破性出血（多发生在漏服药时，必要时可每晚加服炔雌醇 0.01 mg），闭经。③精神压抑、头痛、疲乏、体重增加，面部色素沉着。④肝功能损害，或使肝良性腺瘤相对危险性增高。⑤ 35 岁以上的吸烟妇女，服用本品患缺血性心脏病危险性增加。⑥可能引起高血压。(2) 外用膜剂：①偶见过敏反应，可使女性外阴或阴道甚至男性阴茎发生较严重的刺激症状，如局部瘙痒、疼痛。②少数患者局部有轻度刺激症状，阴道分泌物增多。

【用法与用量】(1) 口服（片剂）：从月经周期第 5 日开始，一日 1 片，连服 22 日，不能间断，服完等月经来后第 5 日继续服药。(2) 阴道内给药（膜剂）：从月经周期第 5 日开始，每日取 1 片，置阴道深处，连用 22 日，不能间断。停药后 3 ~ 7 日行经，于行经的第 5 日开始使用下一周期药物，产后或流产后应在月经来潮后再用。

【制剂与规格】复方炔诺酮片：炔诺酮 0.6 mg，炔雌醇 0.035 mg。

复方炔诺酮膜：炔诺酮 0.6 mg，炔雌醇 0.035 mg。

复方左炔诺孕酮片（滴丸）

Compound Levonorgestrel Tablets (Pills)

【适应证】用于女性口服避孕。

【注意事项】(1) 服用本品时应当每年进行体检，在体检过程中向医师说明正在服用本品。(2) 出现下列症状时应停药：怀疑妊娠、血栓栓塞病、视觉障碍、高血压、肝功能损害、精神抑郁、缺血性心脏病等。(3) 必须按规定方法服药，若漏服药不仅可发生突破性出血，还可导致避孕失败。一旦发生漏服，除按常规服药外，应在 24 小时内加服 1 片。(4) 哺乳期妇女应于产后半年开始服用。(5) 如欲妊娠，应停药并采取其他避孕措施，停药半年后再妊娠。(6) 三相片因生产企业或品牌不同，各相颜色可能不同，使用者务必仔细阅读药品使用说明书，以免错服。

【禁忌证】(1) 乳腺癌、生殖器官癌、阴道有不规则出血、肝功能不全、近期有肝病或黄疸史、深部静脉血栓、脑血管意外、高血压、心血管病、糖尿病、高脂血症、精神抑郁症。(2) 40 岁以上妇女。

【不良反应】可见恶心、呕吐、头晕、乏力、嗜睡等类早孕反应及不规则出血，偶有乳房胀、皮疹、痤疮、体重增加、降低高密度脂蛋白。

【用法与用量】口服：(1) 片剂、滴丸，从每次月经来潮的第 5 日开始服药，一日 1 片，连服 22 日，不能间断、遗漏，服完后等月经来潮的第 5 日，再继续服药。(2) 三相片，首次服药从月经的第 3 日开始，每晚 1 片，连续 21 日，先服黄色片 6 日，继服白色片 5 日，最后服棕色片 10 日。以后各服药周期均于停药第 8 日按上述顺序重复服用，不得漏服。若停药 7 日，连续 2 个月闭经者，应咨询医师。首次服药从月经的第 3 日开始时，推荐在第一个治疗周期服药的头 7 日内，加用屏障避孕法。

（3）长效避孕片：①初次服用本品，于月经来潮当日算起，第5日午饭后服第1片，间隔20日服第2片；或月经第5日及第10日各服1片，以后均以第二次服药日期每月服1片。②原服用短效口服避孕药改服长效避孕药时，可在服完22片短效避孕药后的第二日接服长效避孕药1片，以后每月按开始服长效避孕药的同一日期服药1片。

【制剂与规格】复方左炔诺孕酮片：左炔诺孕酮0.15 mg，炔雌醇0.03 mg。

复方左炔诺孕酮滴丸：左炔诺孕酮0.15 mg，炔雌醇0.03 mg。

复方左炔诺孕酮片（三相片）：黄色片，每片含左炔诺孕酮0.05 mg、炔雌醇0.03 mg；白色片，每片含左炔诺孕酮0.075 mg、炔雌醇0.04 mg；棕色片，每片含左炔诺孕酮0.125 mg、炔雌醇0.03 mg。

复方左炔诺孕酮长效避孕片：左炔诺孕酮6 mg，炔雌醚3 mg。

复方甲地孕酮片（注射液）

Compound Megestrol Tablets (Injectlon)

【适应证】用于女性口服避孕。

【注意事项】（1）片剂：①服药期间，应定期体检，发现异常应及时停药就医。②出现下列症状时应停药，怀疑妊娠、血栓栓塞病、视觉障碍、高血压、肝功能异常、精神抑郁、缺血性心脏病等。③必须按规定方法服药，漏服药不仅可发生突破性出血，还可导致避孕失败。一旦发生漏服，除按常规服药外，应在24小时内加服1片。④哺乳期妇女应于产后半年开始服用。（2）注射剂：①需按时注射，以免影响避孕效果和引起月经的改变。②为防止过敏性休克，注射后应留院观察15～20分钟。③子宫肌瘤、高血压患者慎用。④定期体检，包括乳腺、肝功能、血压和宫颈刮片的检查，发现异常者应立即停药。⑤注射后，一般维持14日左右月经来潮，如注射后闭经，可隔28日再注射一次。如闭经达2个月，应停止注射，等待月经来潮，闭经期间要采用其他方法避孕，待月经来后再按第一次方法，重新开始注射。⑥注射后，可能出现月经改变，如经期延长、周期缩短、经量增多及不规则出血等，其发生率在用药半年后明显下降。当发生此种不良反应时，可及时按以下方法处理。经期延长，以出血较多日期时，可口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，一日1～2片，连服4日，即可止血，在下次经前7日依同法连服4日，可预防出血，如此应用3个月后即停用，如再出血，可依上法再用；月经后出血，每日服炔诺酮0.0125～0.025 mg，直到下次注射日期为止，但若已接近下次注射日期者，可不必处理；月经周期缩短，注射后10日开始加服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，一日1～2片，连服4～6日；注射后长期出血不止，可口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片4日，出血停止后1周，注射本品1支，于注射第11日，口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，一日1～2片，连服4日，可预防出血。

【禁忌证】（1）乳腺癌、生殖器官癌、肾功能不全、肝功能不全或近期有肝病或黄疸史、深部静脉血栓病、脑血管意外、高血压、心血管病、糖尿病、高脂血症、甲状腺功能亢进、精神病或抑郁症患者。（2）40岁以上妇女。（3）孕妇。

【不良反应】（1）片剂：①类早孕反应，表现为恶心、呕吐、困倦、头晕、食欲缺乏。②突破性出血（多发生在漏服药时，必要时可每晚加服炔雌醇0.01 mg），闭经。③精神压抑、头痛、疲乏、体重增加，面部色素沉着。④肝功能损害，或使肝良性腺瘤相对危险性增高。⑤35岁以上的吸烟妇女，服用本品患缺血性心脏病危险性增加。⑥可能引起高血压。（2）注射剂：①少数患者在用药后有恶心、呕吐、头晕、有乳房胀痛、乏力、疲乏等反应，一般反应较轻，不需处理。个别可发生高血压，停药后多可恢复正常。②使用过程中，如乳房有肿块出现，应立即停止。③个别可有过敏反应，不可再注射。

【用法与用量】（1）口服：于每次月经第5日开始，一日1片，连服22日。停药后3～7日行经，于行经的第5日再服下一个周期的药。产后或流产后在月经来潮再服。服药1个月可以避孕1个月，

因此需要每个月服药。一般在睡前服，可减少不良反应。(2)肌内注射：1个月1次。具体方法为，第1个周期，注射2次，分别于月经来潮当日算起的第5日和第12日各注射1支。第2个周期，按第2次注射日期计算，每隔30～31日注射1支，或于每月行经第10～12日注射1支。

【制剂与规格】复方醋酸甲地孕酮片：甲地孕酮1 mg，炔雌醇0.035 mg。

复方甲地孕酮注射液：1 ml：醋酸甲地孕酮25 mg，雌二醇3.5 mg。

去氧孕烯炔雌醇

Desogestrel and Ethinylestradiol

【适应证】用于女性口服避孕。

【注意事项】(1) 开始服药前应体检，采集完整的个人和家族病史，特别注意检查血压。(2) 连续服用3个月以上，应去医院进行体检。服用本品时应当每年进行体检，在体检过程中向医师说明正在服用本品。(3) 在7日的停药期中通常会出现撤退性出血，通常在最后一次服药后2～3日发生，且可能持续到服用下一个周期的药品前还不会结束。(4) 有下列情况者慎用：①肯定的静脉血栓家族病史、延长固定术、外科手术（尤其是腿部外科手术）或外伤、肥胖（体重指数超过30 kg/m^2)；②吸烟（年龄超过35岁，每日吸烟超过20支)、异常脂蛋白血症、高血压、心脏瓣膜疾病、动脉纤维性颤动、肯定的家庭病史；③糖尿病，系统性红斑狼疮，溶血-尿毒症综合征，慢性肠炎性疾病（克罗恩病或溃疡性结肠炎)；④高脂血症患者。(5) 出现听力或视觉障碍、持续血压升高、胸部锐痛或突然气短、偏头痛、乳房肿块、癫痫发作次数增加、严重腹痛或腹胀、皮肤黄染或全身瘙痒等情况应当停止用药。(6) 漏服处理。①如果漏服在12小时之内，避孕效果不会降低。一旦想起立即补服，并在常规时间服用下1片。如果漏服超过12小时，避孕效果可能降低，可以按以下的建议进行漏服处理：漏服发生在第1周，在想起时立即补服，即使这意味着同时服用2片药，然后按常规时间服用剩下的药片。随后的7日应同时采取屏障避孕（如避孕套)，漏服的前7日内有性生活，则有妊娠的可能性。漏服的药片越多，距停药期越近，妊娠的危险越高。漏服发生在第2周。在想起时立即补服，即使这意味着同时服用2片药。然后按常规时间服用剩下的药片。如果在漏服药片前的7日连续正确服药，不用采取其他避孕措施。如果在漏服药片前的7日没有连续正确服药，或漏服超过1片，在接下来的7日建议同时采用屏障法避孕（如避孕套)。漏服发生在第3周。方法一：在想起时立即补服，即使这意味着同时服用2片药，在常规时间服用剩下的药片。一旦本盒药服完，立即开始服用下一盒，因此其间无停药期。在第二盒药服完之前可能没有撤退性出血，但是服药期间可能有点滴性出血或突破性出血。方法二：也可停止服用本盒药，停药7日（包括漏服药片的那日)，然后继续服用下一盒。如果妇女漏服药片，并在停药期无撤退性出血，则应考虑妊娠的可能性。②发生呕吐时的处理。如果在服药的3～4小时呕吐，药物的活性成分可能还未被完全吸收。这如同漏服1片药。因此按漏服处理或遵医嘱。如果不想改变正常的服药顺序，可从下一盒中服用多余的药片。

【禁忌证】(1)有下述任一情况者禁用：有或曾有血栓（静脉或动脉)、栓塞前驱症状（如心绞痛和短暂性脑缺血发作)、存在一种严重的或多个静脉或动脉血栓栓塞的危险因子、伴血管损害的糖尿病、严重高血压、严重异常脂蛋白血症、已知或怀疑的性激素依赖的生殖器官或乳腺恶性肿瘤、肝脏肿瘤（良性或恶性)、有或曾有严重肝脏疾病、肝功能未恢复正常、不明原因的阴道出血。(2) 已妊娠或怀疑妊娠、哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 开始服药的几个周期时会出现一些轻度的反应，如恶心、头痛、乳房胀痛以及在月经周期中出现点滴的出血。(2) 少见的不良反应包括：呕吐、情绪抑郁，不能耐受接触镜，阴道分泌物改变，各种皮肤不适（如皮疹)，体液潴留，体重改变，过敏反应，性欲改变。

【用法与用量】口服：在月经来潮的第1日开始服用本品，一次1片，一日1次，约于每日的同一时间服用，连续服21日，

随后停药 7 日。在停药的第 8 日开始服用下一个周期药品。

【制剂与规格】去氧孕烯炔雌醇片：去氧孕烯 0.15 mg，炔雌醇 30μg。

复方孕二烯酮片

Compound Gestodene Tablets

【适应证】用于女性口服避孕。

【注意事项】(1) 开始服药前应体检，采集完整的个人和家庭病史，特别注意检查血压。(2) 必须按规定方法服药，若漏服药不仅可发生突破性出血，还可导致避孕失败。一旦发生漏服，除按规定服药外，应在 24 小时内加服 1 片。(3) 出现下列症状时应停药：怀疑妊娠、血栓栓塞病、听力或视觉障碍，高血压、肝功能异常、精神抑郁、缺血性心脏病、胸部锐痛或突然气短、偏头痛、乳腺肿块、癫痫发作次数增加、严重腹痛或腹胀、皮肤黄染或全身瘙痒等。(4) 吸烟可使服用本品的妇女发生心脏病和卒中的危险性增加，尤其是 35 岁以上的（含 35 岁）妇女，故服药期间应戒烟。(5) 如欲妊娠，应停药并采取其他避孕措施，停药半年后再妊娠。

【禁忌证】(1) 乳腺癌、生殖器官癌、肝功能不全或近期有肝病或黄疸史、阴道异常出血、镰状细胞性贫血、深部静脉血栓病、脑血管意外、高血压、心血管病、高脂血症、精神抑郁症患者。(2) 哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、头痛、乳房痛、月经间隔期有少量出血。(2) 少见抑郁、皮疹及不能耐受接触镜。(3) 严重可见血栓形成、高血压、肝功能损害、黄疸及过敏反应等。

【用法与用量】口服：自月经周期第 1 日起，每日在相同时间服白色药片（含药药片）1 片，连服 21 日，随后每日在相同时间服红色药片（空白药片）1 片，连服 7 日，共服 28 片。服完最后一片红色药片后开始服用下一周期（盒）药品。

【制剂与规格】复方孕二烯酮片：孕二烯酮 0.075 mg，炔雌醇 0.03 mg。

复方醋酸环丙孕酮片

Compound Cyproterone Acetate Tablets

【适应证】用于女性口服避孕。

【注意事项】(1) 开始服药前应体检，采集完整的个人和家庭病史，特别注意检查血压。(2) 服用本品时应当每年进行体检，在体检过程中向医师说明正在服用本品。(3) 必须按规定方法服药，若漏服药不仅可发生突破性出血，还可导致避孕失败。一旦发生漏服，除按规定服药外，应在 24 小时内加服 1 片。(4) 吸烟妇女，尤其是 35 岁以上的（含 35 岁）妇女，服药期间应戒烟。(5) 如欲妊娠，应停药并采取其他避孕措施，直到出现第一个月经周期后再妊娠。

【禁忌证】(1) 血栓形成（静脉或动脉）或有血栓形成的病史、存在血栓形成的前驱症状或曾有相关病史、累及血管的糖尿病、存在静脉或动脉血栓形成的严重或多重危险因素、存在或曾有严重的肝脏疾病，且肝功能指标没有恢复正常、存在或曾有肝脏肿瘤（良性或恶性）史、已知或怀疑生殖器官或乳腺存在受性甾体激素影响的恶性肿瘤、未确诊的阴道出血患者。(2) 已知或怀疑妊娠的妇女及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 严重不良反应，包括怀疑妊娠、血栓栓塞病、听力或视觉障碍，高血压、肝功能异常、精神抑郁、缺血性心脏病、胸部锐痛或突然气短、偏头痛、乳腺肿块、癫痫发作次数增加、严重腹痛或腹胀、皮肤黄染或全身瘙痒等。(2) 其他不良反应，包括乳房触痛、疼痛、分泌；头痛、偏头痛、性欲改变、情绪抑郁、恶心、呕吐、阴道分泌物改变、各种皮肤疾病、体液潴留、体重变化、过敏反应、肝功能异常、血清三酰甘油升高。

【用法与用量】口服：①既往没有使用激素避孕药（过去 1 个月），于每次月经出血的第 1 日开始服药，从药盒中取出标记该周日期的药片始用，以后每日按顺序服用，直至服完 21 片，随后 7 日不服药。即使月经未停也要在第 8 日开始服用下一盒药。应在每日大约相同的时间服药，也可以在第 2 ~ 5 日开始服药，但推

荐在第一个治疗周期服药的头 7 日内，加用屏障避孕法。②从单纯孕激素方法（微丸、注射液、埋置剂）改服，可在任何时间从微丸（埋置剂应在取出日，注射液应在下一次注射日）改服复方醋酸环丙孕酮片，但应在服药的最初 7 日内加用屏障避孕法。③早期妊娠流产后，可以立即开始服药。在这种情况下，不需要加用其他避孕方法。④分娩或中期妊娠流产后，建议妇女在分娩或中期妊娠流产后 21 ~ 28 日开始服药。如果开始较晚，应在服药的最初 7 日内加用屏障法。然而，如果已经发生性行为，在实际开始服用复方醋酸环丙孕酮片之前，应该除外妊娠，或者妇女要等到她的下一次月经来潮时再服用。

【制剂与规格】复方醋酸环丙孕酮片：醋酸环丙孕酮 2 mg，炔雌醇 0.035 mg。

复方庚酸炔诺酮注射液

Compound Norethisterone Enanthate Injection

【适应证】健康育龄妇女避孕用，尤其适用于不能耐受或坚持服用口服避孕片以及放置宫内节育器易脱落者。

【注意事项】(1) 必须按时注射，并注意将药液抽取干净完全注入，做深部肌内注射。(2) 本品在气温低流动性差时，置热水中温热，待恢复流动性后即可使用。

【禁忌证】急性肝炎、慢性肝炎、肾炎、高血压及有乳房肿块者禁用。

【不良反应】(1) 少见发生月经改变、周期缩短、经量减少、不规则出血及闭经。(2) 偶见恶心、头晕、乳房肿胀等，一般均较轻微，不需处理。必要时可对症处理。

【用法与用量】肌内注射：1 个月 1 次，可以避孕 1 个月。首次给药时，可于月经来潮第 5 日同时注射 2 ml。自第 2 个月起，均在月经第 10 ~ 12 日注射 1 ml。

【制剂与规格】复方庚酸炔诺酮注射液：1 ml 中含庚酸炔诺酮 50 mg 和戊酸雌二醇 5 mg。

复方己酸羟孕酮注射液

Compound Hydroxyprogesterone Caproate Injection

【适应证】用于女性长效避孕。

【注意事项】(1) 需按时注射，以免影响避孕效果和引起月经的改变。(2) 为防止过敏性休克，注射后应留院观察 15 ~ 20 分钟。(3) 定期体检，包括乳腺、肝功能、血压和宫颈刮片的检查，发现异常者应立即停药。(4) 子宫肌瘤、高血压患者慎用。(5) 注射后，一般维持 14 日左右月经来潮，如注射后闭经，可隔 28 日再注射 1 次。如闭经达 2 个月，应停止注射，等待月经来潮，闭经期间要采用其他方法避孕，待月经来后再按第一次方法，重新开始注射。(6) 注射后，有人可出现月经改变，如经期延长，周期缩短，经量增多及不规则出血等，其发生率在用药半年后明显下降。当发生此种不良反应时，可及时按以下方法处理：①经期延长。已出血较多日期时，可口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，一日 1 ~ 2 片，连服 4 日，即可止血，在下次经前 7 日依同法连服 4 日，可预防出血，如此应用 3 个月后即停用，如再出血，可依上法再用。②月经后出血。每日服炔诺酮 0.0125 ~ 0.025 mg，直到下次注射日期为止。但若已接近下次注射日期者，可不必处理。③月经周期缩短。注射后 10 日开始加服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，一日 1 ~ 2 片，连服 4 ~ 6 日。④注射后长期出血不止。可口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片 4 日，出血停止后 1 周，注射本品 1 支，于注射第 11 日，口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，每日 1 ~ 2 片，连服 4 日，可预防出血。

【禁忌证】(1) 肝肾功能不全、心血管疾病和血栓史、高血压、糖尿病、甲状腺功能亢进、精神病或抑郁症、高血脂、子宫肌瘤、乳房肿块患者。(2) 孕妇。

【不良反应】(1) 少数患者在用药后有恶心、呕吐、头晕、乳房胀痛、乏力、疲乏等反应，一般反应较轻，不需处理。个别可发生高血压，停药后多可恢复正常。(2) 使用过程中，如乳房有肿块出现，应立即停止。

【用法与用量】深部肌内注射：第一次在月经周期的第 5 日肌内注射 2 ml，或分别于月经来潮第 5 日及第 15 日各肌内注射 1 ml，以后于每个月月经周期的第 10 ~ 12 日肌内注射 1 ml。若月经周期短，

宜在月经来潮第10日注射，即药物必须在排卵前2～3日注射，以提高避孕效果。必须按月注射。

【制剂与规格】复方己酸羟孕酮注射液：1 ml中含己酸羟孕酮250 mg，戊酸雌二醇5 mg。

醋酸甲羟孕酮注射液

Medroxyprogesterone Acetate Injectable Suspension

【适应证】女性用长效注射避孕。

【注意事项】(1)使用醋酸甲羟孕酮前，应排除生殖器官或乳房恶性肿瘤的存在。(2)每3个月由深部肌内注射1针，避孕有效率达99%以上。必须按时重复注射，如不能按时注射，可以提前注射，两次注射间隔超过14周时，再次重复注射前应排除妊娠。(3)使用醋酸甲羟孕酮后如出现血栓异常方面的征兆，继续使用前应仔细权衡利弊和治疗的需要。(4)长期大剂量使用醋酸甲羟孕酮可能造成体重增加及体液潴留，对于有此症状的患者可能会使体重增加及加重体液潴留状况，故应注意。(5)低剂量醋酸甲羟孕酮对有些患者可能会降低糖耐量，尤其糖尿病患者应注意。(6)有精神抑郁史的患者，接受醋酸甲羟孕酮治疗时应严密监测，有些患者会出现类似经前期抑郁症的情况。(7)单剂量或多剂量使用醋酸甲羟孕酮，其长期的抑制排卵作用可造成闭经和(或)月经紊乱。

【禁忌证】(1)不明原因的阴道出血者。(2)产后6周内的母乳喂养者。(3)现患或曾患深部静脉血栓、肺栓塞，缺血性心脏病或脑血管意外患者。(4)有局灶性神经症状的偏头痛患者。(5)活动期肝炎，肝硬化失代偿期或肝脏肿瘤患者。(6)曾患乳腺癌，5年内无复发迹象者。(7)经常服用影响肝酶代谢药物者，如利福平、灰黄霉素及某些抗惊厥药等。

【不良反应】(1)过敏和类过敏性反应。(2)血栓栓塞症：血栓性静脉炎及肺栓塞。(3)中枢神经系统：紧张、失眠、嗜睡、疲倦、抑郁、眩晕和头痛。(4)皮肤和黏膜：荨麻疹、瘙痒、红疹、痤疮、多毛和脱发。(5)胃肠道：恶心。(6)乳房：肿胀和溢乳。(7)其他：发热、体重变化和满月脸。

【用法与用量】深部肌内注射：一次0.15 g，每3个月1次。首次注射应在正常自发月经的头5日之内使用；产后不哺乳妇女产后5日之内即可使用；产后哺乳妇女在分娩6周后即可使用。

【制剂与规格】醋酸甲羟孕酮注射液：1 ml : 0.15 g。

复方炔诺孕酮二号片

Compound Norgestre Tablets Ⅱ

【适应证】用于女性长效避孕。

【注意事项】服药后可能出现恶心、呕吐、头晕、乳房肿胀、白带增多等，一般于连续服药几次后不再出现或减轻；如加服抗不良反应的药片（主要含奋乃静、颠茄、咖啡因、维生素B_6等）便可缓解。

【禁忌证】(1)肝病、肾病、子宫肌瘤、高血压、乳房肿块及有糖尿病史患者。(2)哺乳期妇女。

【用法与用量】口服：于月经第5日服1片，第25日服第2片，以后每隔28日服1片。为保证避孕效果，服药开始3个月，每次服药时须加服炔雌醚0.3 mg。

【制剂与规格】复方炔诺孕酮二号片：炔诺孕酮10 mg和炔雌醚2 mg。

复方炔雌醚片

Compound Quinestrol Tablets

【适应证】女性用长效口服避孕药。

【注意事项】(1)长期服药者少数人有血压升高、糖代谢轻度变化，故高血压和有糖尿病史患者慎用。(2)如果服药2个周期，月经均未来潮，应及时停药，并排除妊娠的可能性。

【禁忌证】(1)肝病、肾炎、子宫肌瘤、乳房肿块患者。(2)哺乳期妇女。

【不良反应】开始时可见恶心、呕吐、头晕、乏力、食欲缺乏、白带增多、乳房胀等不良反应，但随服药时间延长症状可减轻或消失。个别有月经量增多或短暂闭经。

【用量与用法】口服：于月经周期第5日口服1片，以后每隔25日服1片。

【制剂与规格】复方炔雌醚片：氯地孕酮12 mg、炔雌醚3 mg。

三合一炔雌醚片：氯地孕酮6 mg，

甲炔诺酮 6 mg，炔雌醚 2 mg。

【用法与用量】口服：于月经第5日服1片，隔 5 日加服 1 片，此后每月按第一次服药日期服药。

三合一炔雌醚片 氯地孕酮 6 mg，甲炔诺酮 6 mg、炔雌醚 2 mg。口服：于月经第 5 日服 1 片，隔 5 日加服 1 片，以每月按第一次服药日期服药。

炔诺酮[保(乙)]

Norethisterone

【适应证】用于女性探亲时短效避孕。

【注意事项】本品为探亲避孕药，如同居超过 14 日，应改用短效口服避孕药，且 1 年内服用本品不得超过 2 个周期。

【禁忌证】心血管疾病、肝肾疾病、糖尿病、哮喘病、癫痫、偏头痛、血栓性疾病、胆囊疾病及精神病患者。

【不良反应】可见食欲缺乏、恶心、头晕、倦怠、阴道不规则出血。

【用法与用量】口服：自同居当晚起，每晚 3 mg，10 日之内必须连服 10 日，若同居半个月，连服 14 日。

【制剂与规格】炔诺酮片：① 3mg；② 5mg。

炔诺酮滴丸：① 3 mg；② 5 mg。

复方双炔失碳酯肠溶片

Compound Anorethidrane Dipropionate Enteric-coated Tablets

【适应证】用于探亲或新婚夫妇避孕药。

【注意事项】(1) 服药后月经周期延长或闭经者，可加服甲地孕酮 25 mg 和炔诺酮 0.015 mg 催经。(2)不良反应严重者，每日可加服维生素 B_6 20 mg 或维生素 C 100 mg。(3) 1 年内最多服 2 个周期。

【禁忌证】(1) 严重肝肾功能不全、人工流产不到 6 个月及腹泻患者。(2) 孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 开始服药时常见恶心、呕吐、乏力、眩晕、嗜睡等。(2) 偶见阴道出血、经量增多或减少、白带增多、乳房肿胀、腹胀等。

【用法与用量】口服：于第一次房事后立即服用本品 1 片，次日晨须加服 1 片，以后每次房事后最多一日服 1 片，每个月经周期不少于 12 片。如果探亲结束时还未服完 12 片，则需继续一日服 1 片，直至服满 12 片。如已服完 12 片，但探亲未结束，每次房事后仍需服用 1 片。

【制剂与规格】复方双炔失碳酯肠溶片(53 号探亲抗孕片)：双炔失碳酯 7.5 mg，咖啡因 20 mg，维生素 B_6 30 mg。

甲地孕酮探亲避孕片 1 号

Megestrol Holiday Tablets Ⅰ

【适应证】用于探亲时避孕用。

【注意事项】子宫肌瘤、血栓病史、高血压、糖尿病、哮喘病、癫痫、偏头痛、精神抑郁患者慎用。长期用药注意检查乳房及肝功能。

【禁忌证】严重肝、肾功能不全、乳房肿块、孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】恶心、头晕、倦怠、突破性出血，孕妇服用增加女性后代男性化的作用。

【用法与用量】口服，在探亲当日中午口服 1 片，当日晚上加服 1 片，以后每日晚上服 1 片，直至探亲结束，次日再服 1 片。

【制剂与规格】甲地孕酮探亲避孕片 1 号：2 mg。

左炔诺孕酮

Levonorgestrel

【适应证】用于女性紧急避孕，即在无防护性措施或其他避孕方法偶然失误时使用。

【注意事项】(1) 如服药后 2 小时内发生呕吐反应，应立即补服 1 片。(2) 可能使下次月经提前或延期，如逾期 1 周月经未来潮，应立即到医院检查，以排除妊娠。怀疑妊娠者应先做妊娠试验，确诊妊娠者服用本品无效。(3) 服药到下次月经前应避免同房或务必使用避孕套。(4) 严重心脑血管疾病、急性偏头痛、严重肝肾功能不全者慎用。

【禁忌证】(1) 乳腺癌、生殖器官癌、静脉血栓病、脑血管意外、高血压、心血管病、糖尿病、高脂血症、精神抑郁患者。

(2) 哺乳期妇女及40岁以上妇女。

【不良反应】偶见恶心、呕吐，一般不需处理，可自行消失。

【用法与用量】口服：于房事后72小时内服第1片，隔12小时后服第2片，总量为2片。服药后不得有无防护性同房，月经来潮后采用常规避孕方法。

【制剂与规格】左炔诺孕酮片：0.75 mg。

壬苯醇醚

Nonoxinol

【适应证】杀精子药，用于阴道避孕。

【注意事项】(1) 本药可致胎儿畸形，避孕失败者应尽早终止妊娠。(2) 给药说明：①应将药物放置在阴道深部，覆盖在宫颈口或附近；②药物送入阴道后不要起床，以免药物溢出；③必须在药物溶解后才能开始性交；④用药后如30分钟内未行房事，应再用药1次，以保证避孕效果；⑤房事后6～8小时不要冲洗阴道。

【禁忌证】(1) 可疑生殖道恶性肿瘤者。(2) 有不规则阴道出血、阴道炎症、子宫脱垂或阴道壁松弛者。(3) 怀疑妊娠者。

【不良反应】(1) 偶见过敏反应，可致女性外阴、阴道及男性阴茎瘙痒、疼痛、充血及水肿。(2) 少数使用者局部有轻度刺激症状、阴道分泌物增多及烧灼感。

【用法与用量】阴道给药：①壬苯醇醚膜，可男用也可女用，一般以女用为好。房事前取药膜1张（含本药50 mg），对折2次或揉成松软小团，以示指或中指推入阴道深部，10分钟后可行房事；如男用，则将药膜贴于阴茎头，推入阴道深处，房事开始时间与女用相同。最大用量一次不超过100 mg。②壬苯醇醚阴道片，一次100 mg，于房事前5分钟放入阴道深处。如阴道分泌物较少的妇女，可以用洁净水稍湿药片后，迅速放入阴道深处。③壬苯醇醚海绵剂。使用时用清洁水浸湿，挤去过量的水，深置阴道中，房事后留置6小时，但不超过30小时，也不能重复使用。④壬苯醇醚栓，一次75 mg或100 mg，房事前5分钟放入阴道深处。⑤壬苯醇醚胶胨、霜剂或泡沫剂药物。用注入器将药物注入阴道深部，应注意将一支药全部挤出，并均匀地涂在子宫颈口和周围，立即可以生效。这3种剂型均可起到润滑作用，最好能与阴茎套或阴道隔膜等合并使用，可增加避孕效果。

【制剂与规格】壬苯醇醚阴道片：100 mg。

壬苯醇醚膜：①50 mg；②75 mg；③100 mg。

壬苯醇醚海绵剂：1 g。

壬苯醇醚栓：①40 mg；②50 mg；③75 mg；④100 mg。

壬苯醇醚胶胨剂：200 mg。

左炔诺孕酮硅胶棒

Levonorgestrel Silastic Implants

【适应证】用于要求长期避孕的育龄妇女。

【注意事项】(1) 既往月经不调者、经常有闭经史者、产后或流产后尚未恢复正常月经者、哺乳期或45岁以上妇女不宜使用本品。(2) 如妇女规则使用巴比妥类、苯妥英钠、解热镇痛、保泰松、利福平和四环素等药，可影响本品的避孕效果。(3) 计划妊娠者，需在取出6个月后方可受孕。(4) 置入本品的妇女应定期到手术医疗单位进行随访观察。(5) 埋植期间，如置入者发生妊娠，建议人工流产终止妊娠，并取出埋置物。

【禁忌证】急慢性肝炎、肾炎、肿瘤、糖尿病、甲状腺功能亢进、严重高血压、血栓性疾病、镰状细胞贫血、原因不明的阴道出血、癫痫、可疑妊娠者和应用抗凝血药者。

【不良反应】可见月经紊乱（月经过频、经期延长、月经稀发、闭经或点滴出血等）、类早孕反应（恶心、头晕、乏力、嗜睡等）、乳房胀痛；偶见体重增加、血压升高、痤疮、精神抑郁或性欲改变等。

【用法与用量】埋植：于月经周期的第1周内（从月经来潮的第1日算起），局麻无菌条件下，在上臂或股内侧皮肤上做一个0.2 cm切口，用套管针将埋置物放入皮下。外敷创可贴，纱布包扎即可。每人一次2支，有效避孕期4年。

【制剂与规格】左炔诺孕酮硅胶棒：75 mg。

左炔诺孕酮宫内节育系统

Levonorgestrel Intrauterine System

【适应证】用于女性避孕。

【注意事项】(1) 如有下列任何一种情况存在或使用期间首次出现，应考虑取出该系统：偏头痛、局灶性偏头痛伴有不对称的视力丧失或提示有暂时性脑缺血的其他症状，特别严重的头痛，黄疸，明显增高的血压，肯定或可疑的激素依赖性肿瘤包括乳腺癌，严重的动脉性疾病如卒中或心肌梗死。(2) 如果出现血栓形成的症状或体征，应立即采取恰当的诊断和治疗措施。(3) 有先天性心脏病或有感染性心内膜炎危险的瓣膜性心脏病的妇女慎用。(4) 低剂量的左炔诺孕酮可能影响糖耐量，所以糖尿病妇女使用左炔诺孕酮宫内节育系统时应监测血糖浓度。(5) 不规则出血可能掩盖了子宫内膜息肉或癌的一些症状和体征，对于这些病例应考虑诊断性措施。(6) 左炔诺孕酮宫内节育系统不是年轻未产妇的首选方法，也不适合子宫非常萎缩的绝经后妇女。(7) 放置前应做体格检查，包括盆腔检查、乳腺检查及宫颈涂片。应该除外妊娠和性传播疾病，生殖道感染必须彻底治疗。(8) 应确定子宫的位置和宫腔的大小。为了保证子宫内膜均匀地暴露于孕激素下、防止脱落和达到最佳的效果，宫内节育系统的基准定位特别重要。因此，应认真遵循放置说明。(9) 放置后4 ~ 12周必须随访检查妇女，此后每年1次，如有临床需要可增加随访检查的次数。(10) 生育年龄的妇女，左炔诺孕酮宫内节育系统必须在月经开始的7日以内放入宫腔。用新系统更换左炔诺孕酮宫内节育系统可以在周期的任何时间进行。该系统也可以在早孕流产后立即放置。产后放置应推迟到分娩后6周。(11) 如果在长期的放置期间发生不规则出血，应采取适当的诊断措施。(12) 该系统应在5年后取出。如果使用者希望继续使用同一方法，可以在取出的同时放入一个新的系统。生育年龄妇女如果不希望妊娠，只要仍然有月经周期，取出应该在月经期进行。如果是在月经周期的中期取出该系统，而妇女在取出后1周内有性生活，则有妊娠的危险，除非在取出后当即放入一个新的系统。放置与取出时可能会有一些疼痛与出血。(13) 如果妇女出现复发的子宫内膜炎或盆腔感染、严重的急性感染或经过几日的治疗没有好转，那么必须取出左炔诺孕酮宫内节育系统。有感染可能时，即使症状不明显，也应推荐做细菌学检查及监测。(14) 如果月经出血量增多，可能提示发生脱落。必须取出移位的左炔诺孕酮宫内节育系统。可以同时放置一个新的系统。(15) 宫内节育器可能引起子宫体或宫颈的穿孔或穿透，通常发生在放置时。这种情况下，必须取出该系统。(16) 如果发生下腹痛特别是伴有月经过期或者闭经的妇女开始出血，应该考虑异位妊娠的可能性。左炔诺孕酮宫内节育系统使用者的异位妊娠率为0.06/100妇女年，其显著地低于未使用任何避孕方法的妇女估计的异位妊娠率[(1.2 ~ 1.6)/100妇女年]。(17) 随诊检查时如果在宫颈处未能见到尾丝，必须除外妊娠，并用超声诊断以正确定位该系统，或用X线来定位左炔诺孕酮宫内节育系统。

【禁忌证】已知或怀疑妊娠者；现患盆腔炎或盆腔炎复发、下生殖道感染、产后子宫内膜炎、过去3个月内有感染性流产、宫颈炎、宫颈非典型增生、子宫或宫颈恶性病变；先天性或获得性子宫异常，包括使宫腔扭曲的肌瘤、增加感染易感性的疾病、急性肝脏疾病或肝肿瘤；对该系统组成成分过敏者。

【不良反应】(1) 发生月经出血类型的改变，包括点滴出血、月经期缩短或延长、不规则出血、月经过少、闭经、出血过多。(2) 其他不良反应：头痛（包括罕见的偏头痛）、下腹痛、腰痛、痛经、皮肤疾病（如痤疮、皮疹及瘙痒）、阴道分泌物、乳痛和其他良性乳房情况、阴道炎、抑郁和其他情绪改变、恶心及水肿、体重增加、脱发或油脂性头发、多毛症及腹胀、避孕失败引起的异位妊娠、严重的盆腔炎症。(3) 整个节育系统或部分有可能穿透子宫壁，可能发生卵泡增大(功能性卵巢囊肿)。

【用法与用量】于月经后第3 ~ 7日，置入宫腔底部。使用期5年。左炔诺孕酮

宫内节育系统体内溶出速率开始时约为每日 20μg，5 年后降为约每日 11μg。左炔诺孕酮在 5 年时间内的平均溶出速率约为每日 14μg。

【制剂与规格】左炔诺孕酮宫内节育系统：含左炔诺孕酮 52 mg。

黄体酮节育器

Progestasert

【适应证】用于女性避孕。

【不良反应】主要有不规则出血和闭经。

【用法与用量】于月经后第 3 ~ 7 日，置入宫腔底部。使用期 1 年。

【制剂与规格】黄体酮节育器：黄体酮 38 mg。

12.10 终止妊娠用药

12.10.1 药物流产

应用药物终止早期妊娠（妊娠 < 49 日）。米非司酮一次 50 mg，一日 2 次，连续 2 日，于第 3 日配伍米索前列醇 600μg 顿服。服药前后 2 小时禁食。

12.10.2 引产用药

用于妊娠 16 ~ 27 周的引产。(1) 依沙吖啶：羊膜腔内注射药物，安全剂量 100 mg，需做过敏试验。(2) 米非司酮 + 前列腺素：米非司酮 200 mg 顿服，或一次 25 ~ 50 mg，一日 2 ~ 3 次，连续 3 日，第 3 ~ 4 日清晨于阴道后穹窿放置卡前列甲酯栓 1 mg，或使用其他同类前列腺素药物，其后卧床休息 1 ~ 2 小时，门诊观察 6 小时。(3) 缩宫素引产见前述部分。

米非司酮[保(乙)]

Mifepristone

【适应证】与前列腺素药序贯合并使用，用于终止停经 49 日内的妊娠。

【注意事项】(1) 确认为早孕者，停经天数不应超过 49 日，孕期越短，效果越好。(2) 米非司酮片必须在具有急诊、刮宫手术和输液、输血条件下使用。(3) 服药后，一般会较早出现少量阴道出血，部分妇女流产后出血时间较长。少数早孕妇女服用米非司酮片后，即可自然流产。约 80% 的孕妇在使用前列腺素类药物后，6 小时内排出绒毛胎囊，约 10% 孕妇在服药后 1 周内排出妊娠物。(4) 服药后 8 ~ 15 日应去原治疗单位复诊，以确定流产效果。必要时做 B 型超声波检查或血 HCG 测定，如确诊为流产不全或继续妊娠，应及时处理。(5) 使用本品终止早孕失败者，必须进行人工流产终止妊娠。

【禁忌证】(1) 心、肝、肾功能不全及肾上腺皮质功能不全者。(2) 青光眼、哮喘等属于对使用前列腺素类药物禁忌者。(3) 带宫内节育器妊娠、怀疑宫外孕以及年龄超过 35 岁的吸烟妇女。

【不良反应】可见轻度恶心、呕吐、腹泻、眩晕、疲乏、腹痛、肛门坠胀感、子宫出血、皮疹、面部潮红和麻木。

【用法与用量】口服：停经 49 日内的健康早孕妇女，空腹或进食 2 小时后服用。米非司酮片，一次 25 ~ 50 mg，一日 2 次，连服 2 ~ 3 日，总量 150 mg，每次服药后禁食 2 小时，第 3 ~ 4 日清晨于阴道后穹窿放置卡前列甲酯栓 1 mg（1 枚）。卧床休息 1 ~ 2 小时，门诊观察 6 小时。注意用药后出血情况，有无妊娠产物排出和不良反应。

【制剂与规格】米非司酮片：25 mg。

依沙吖啶[保(乙)]

Ethacridine

【适应证】用于终止 12 ~ 26 周的妊娠。

【注意事项】(1) 羊膜腔内注射不良反应轻，但必须在妊娠 16 周以后，经腹壁能注入羊膜腔内者才能使用此种给药途径。(2) 妊娠 < 16 周，常用宫腔内注药，将导管经阴道放入宫腔内羊膜腔外，经导管将药物注入，这种途径不良反应较大，感染发生率也较高，故现已少用。(3) 用本品引产同时，慎用其他引产药（如缩宫素静脉滴注），以免导致软产道损伤。(4) 如出现体温 39℃ 以上，白细胞计数超过 $20 \times 10^9/L$ 时，应给予抗生素。

【禁忌证】肝功能不全、肾功能不全患者禁用。

【不良反应】(1) 中毒时表现为少尿、无尿及黄疸，肝、肾功能严重损害。(2) 有

3% ~ 4% 孕妇发热可达 38℃以上。(3) 本品引产容易发生胎盘滞留或部分胎盘、胎膜残留而引起大量出血。(4) 软产道损伤，常见宫颈撕裂、宫颈管前壁或后壁穿孔。

【用法与用量】羊膜腔内给药或宫腔内羊膜腔外注药：本品的安全剂量一次 50 ~ 100 mg，极量 120 mg，中毒剂量为 500 mg，一般用量为 100 mg 以内。(1) 羊膜腔内给药：排空膀胱后，孕妇取仰卧位，选择宫体最突出部位，羊水波动明显处为穿刺点，用纱布持 7 号腰穿针垂直刺入腹壁，进入羊膜腔时有落空感，再继续进针 0.5 ~ 1 cm 后拔出针芯，有羊水涌出后，将装有本品 100 mg 溶液的注射器接在穿刺针上，再回抽羊水证实无误后将药液缓缓注入，拔针前须回抽羊水。拔针前将针芯插入针内快速拔针后，敷盖消毒纱布，压针眼。(2) 宫腔内羊膜腔外注药：孕妇膀胱排空后取膀胱截石位，常规外阴、阴道、宫颈消毒后，用宫颈钳夹住宫颈前唇，将橡皮导管沿宫颈向宫腔送入，将已配制的本品溶液（内含 100 mg 药物，用注射用水稀释）100 ml 注入导管。导管下端双折用线扎紧，卷折在阴道内，塞纱布以固定，于术后 24 小时取出纱布和导管。

【制剂与规格】乳酸依沙吖啶注射液：① 2 ml : 50 mg；② 5 ml : 100 mg。

(其他见 16.3.2)

第13章 眼科疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案
- 眼部感染
- 过敏性结膜炎
- 青光眼

13.1 眼科疾病用药概论

13.1.1 给药方式和途径

眼科的给药方式是眼局部给药，如将滴眼液（包括溶液、混悬液等）、眼用凝胶或眼膏等滴入或涂入结膜囊内。如果眼部治疗需要较高药物浓度，可以采用眼局部注射方式，如眼周注射（球结膜下注射、球旁注射、球后注射、眼内注射）。

（1）结膜囊内给药：滴入滴眼液的方法通常是嘱患者将头部稍后仰或平卧，眼向上注视。滴药者用手指轻轻向下牵开下睑；然后将药液缓慢地滴入下穹窿部，一般滴用 1 滴即可。轻提上睑使药液在结膜囊内充分弥散。嘱患者轻轻闭合眼睑 2～3 分钟。以干棉球拭去流出结膜囊的药液。眼用凝胶和眼膏的给药方法与滴眼液大致相同，将凝胶或眼膏涂入结膜囊的下穹窿部。用药后闭眼和轻轻按摩眼球有助于药物的扩散。

当两种不同的滴眼液同时使用时，如果用完一种后马上就用第二种，就会发生药物被稀释或药物溢出结膜囊的情况。因此当需要同时使用两种滴眼液时，应当在用完一种至少 5 分钟后再用第二种。滴入结膜囊的药物可以通过结膜血管吸收，或者结膜囊中多余的药物从鼻泪管流入鼻腔，由鼻黏膜吸收而进入全身循环，可以引发全身性效应，其程度与眼部给药的剂型有很大关系。经鼻泪道流入鼻腔的药物多与滴眼液有关，而很少与眼用凝胶和眼膏有关。当滴用滴眼液时，用手指轻压内眦部的泪囊区，可以明显减少药物经鼻泪道流入鼻腔的量，从而减少药物引起的全身效应。

（2）结膜囊冲洗：在清除结膜囊内刺激物、异物或分泌物等急救处置时，可以应用眼用冲洗液冲洗结膜囊。通常使用的眼部冲洗液为无菌的 0.9%氯化钠溶液。在紧急情况下，也可以应用洁净水作为眼部冲洗液。

（3）眼周注射：为了有效地控制病情，或者结膜囊内给药后疗效不显著时，抗感染药、散瞳药或糖皮质激素等可以采用眼周注射方式来给药，将药物直接注入球结膜下、球筋膜下或者球后，使药物通过角膜和巩膜扩散到前房、后房和玻璃体内而发挥治疗作用。眼周注射的单剂量体积是有

限的，通常每次结膜下注射量不超过 1 ml。

(4) 眼内注射：为了有效地控制病情和提高疗效，必要时可以采用眼内注射的方式，包括前房内注射和玻璃体腔内注射来给药。由于药物的剂量 - 容积是有一定限度的，通常单剂量体积不超过 0.3 ml。由于眼内注射有可能发生一些严重的并发症，因此应当慎用。

(5) 全身给药：一些药物，如抗菌药和糖皮质激素，可以采用全身给药的方式，来治疗某些眼部易感的疾病。有些降眼压药物也需要采用全身给药的方法，如口服乙酰唑胺、甘油盐水，静脉滴注高渗剂甘露醇等，来达到快速降低眼压的目标。

13.1.2 控制污染

临床所用的眼用制剂应当是无菌的。对于装在多剂量容器中并且加有防腐剂的滴眼液，在使用时仍然需要注意避免污染。

患者在家中自用的保存于多剂量容器中的眼用药物（包括滴眼液、眼用凝胶和眼膏），在首次开封后使用时间不应当超过 4 周，除非另有说明。

医院病房里使用的眼用药物一般在开封后 1 周弃用，应当给每位患者提供个人专用的眼用药物。如果遇到需要特别关注的污染问题，应当为每只眼提供单独使用的眼用药物容器。

对于出院的患者应当提供未开封的眼用药物。在出院时让患者带走当天已经发给他们的药品是可以接受的做法。

在门诊部，以使用单剂量包装的滴眼液为好。如果使用多剂量包装的滴眼液，应当在一日工作结束时弃用。在意外事件时和急诊等感染高风险的地方，应当尽量使用单剂量包装的滴眼液。如果使用多剂量包装的滴眼液，应当在单次使用后弃用。

诊断用染料，如荧光素钠等，应当尽量使用单剂量包装的药品。如果使用多剂量包装的，应当在一日工作结束时弃用。

手术前使用的滴眼液不宜在手术时使用，应提供未开封的滴眼液。如有可能，眼科手术时应当使用单剂量包装的滴眼液。如果使用多剂量包装的滴眼液，应当为每位患者提供个人专用的滴眼液瓶，并在手术结束时弃用。在施行内眼手术和其他进入前房的处置时所使用的制剂必须是等渗的，而且不含防腐剂和抗氧化剂，如有必要应当加入缓冲液将 pH 调至中性。用于内眼手术的液体应当按特别的处方配制，一般静脉输注的制剂并不适用于这种目的。

13.2 眼部感染及其用药

眼部感染是眼科常见的病变，可以发生在眼睑、眼表和眼内等不同部位，引起睑缘炎、结膜炎、沙眼、角膜炎和眼内炎等疾病。睑缘炎、结膜炎等会造成严重不适。角膜炎可以导致角膜混浊，产生严重的视力下降。眼内炎可以破坏眼球，如不及时控制，会导致失明。引起眼部感染的微生物有细菌、衣原体、真菌和病毒等。睑缘炎和结膜炎通常是由于葡萄球菌感染所引起，沙眼是由于衣原体感染引起，角膜炎和眼内炎可以由细菌、病毒或真菌感染引起。治疗眼部感染的目标是控制感染，保护眼组织及其功能。

13.2.1 抗细菌药

细菌性睑缘炎（bacterial blepharitis）的治疗是将抗菌眼膏涂至结膜囊内或睑缘部分。偶尔需要抗菌药物进行全身治疗，这种治疗通常是在睑缘取样进行微生物培养，确定抗菌敏感性后再进行。给予 3 个月或更长时间的抗菌药物，如四环素类药物是恰当的。

虽然大多数细菌性结膜炎（bacterial conjunctivitis）的病例是自限的，但是应用抗菌滴眼液或眼膏是恰当的治疗措施。如果用药后效果不明显，就表明可能是病毒性或过敏性结膜炎。对于淋球菌性结膜炎应当采用全身及眼局部抗菌药物来治疗。

衣原体感染会导致致盲性沙眼和包涵体性结膜炎。对于衣原体感染的治疗除了注意个人卫生和环境卫生之外，主要是抗菌药物的治疗。急性期或严重的沙眼应当采用口服阿奇霉素（Azithromycin）进行全身治疗，首次 500 mg 口服，以后一日 250 mg，共 4 日为 1 个疗程。为了保证患者的依从性，也可以采用单次口服，剂量为 1 g。眼局部治疗可以滴用抗菌滴眼液

或眼膏，如0.3%氧氟沙星滴眼液、0.25%氯霉素滴眼液、红霉素眼膏、金霉素眼膏，以及0.1%利福平滴眼液等。

对于细菌性角膜溃疡（bacterial corneal ulcer）和角膜炎（keratitis）患者，需要由眼科专科医师进行治疗。如果病情严重，可以将这类患者收住人院，进行加强治疗。

细菌性眼内炎（bacterial endophthalmitis）是一种医学急症，同样需要眼科专科医师进行处理，通常需要采用多种途径，如结膜下注射、前房内注射、玻璃体腔内注射及全身途径来给予抗菌药物。其中以玻璃体腔内注射最为重要，如果是眼科手术后引起的细菌性眼内炎，可以向眼内注人万古霉素1 mg/0.1 ml或头孢他啶2.25 mg/0.1 ml，2～3日后重复注射。

有多种药物可以用于眼局部抗感染治疗。左氧氟沙星是氧氟沙星的左旋体，其抗菌活性约为氧氟沙星的2倍，具有抗菌谱广、作用强的特点，是用于治疗眼部浅层感染的可供选择的药物。滴用左氧氟沙星滴眼液后有很好的耐受性。左氧氟沙星的滴眼液和眼用凝胶均不宜长期使用，以免诱发耐药菌或真菌感染。

氯霉素滴眼液具有广谱抗菌活性，也是治疗眼表浅层感染的可选用的药物，滴用后耐受性良好。由于滴用氯霉素滴眼液后存在不易发现的再生障碍性贫血的风险，因此在临床中应当慎用。

其他具有广谱抗菌活性的抗菌药包括氟喹诺酮类药物，如诺氟沙星、环丙沙星、氧氟沙星，氨基糖苷类药物，如妥布霉素、庆大霉素、新霉素等。妥布霉素、庆大霉素、环丙沙星、左氧氟沙星、氧氟沙星和多黏菌素B对铜绿假单胞菌引起的感染有效。夫西地酸在治疗葡萄球菌感染时是有用的。

氟喹诺酮类药对婴幼儿的安全性尚未确定，可能会对软骨发育有影响，因此对18岁以下儿童不推荐使用，妊娠及哺乳期妇女慎用。

许多抗菌制剂中加人糖皮质激素合并使用。虽然这类制剂具有抗菌、抗炎、加速治愈过程的优点，但有诱发真菌或病毒感染、延缓创伤愈合、升高眼压和导致晶状体混浊等风险，因此不应当随意使用，除非患者是在眼科专科医师的密切监护下。特别是不能给尚未确诊的“红眼病”患者开具这类药物，因为这种情况有时是由于难以诊断的单纯性疱疹病毒感染所致。如果使用这类制剂，不应当超过10日，并应当在使用期间定期测量眼压。

抗菌药物用药的频次取决于感染的严重程度和眼部发生不可逆损伤的可能性。常用眼部抗菌药物制剂的给药方法为：①滴眼液：滴人结膜囊内。一次1滴，可以每2小时1次。感染控制后减少使用频次。痊愈后持续用药48小时。②眼用凝胶或眼膏：涂于结膜囊内。如果白天使用滴眼液，则每晚涂用1次眼用凝胶或眼膏；如果只用眼用凝胶或眼膏，则一日涂用3～4次。

磺胺醋酰钠[保(乙)]

Sodium Sulfacetamide

【适应证】用于结膜炎、睑缘炎，也可用于沙眼衣原体感染的辅助治疗。

【注意事项】(1) 滴眼时瓶口勿接触眼睛。(2) 使用后应将瓶盖拧紧，以免污染药品。(3) 用药部位如有烧灼感、瘙痒、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净，必要时向医师咨询。(4) 过敏体质者慎用。(5) 本品性状发生改变时禁止使用。

【禁忌证】对本品及磺胺类药过敏者禁用。

【不良反应】偶见眼睛刺激或过敏反应。

【用法与用量】滴眼，一次1～2滴，一日3～5次。

【制剂与规格】磺胺醋酰钠滴眼液：15%。

左氧氟沙星[基(基)，保(甲/乙)]

Levofloxacin

【适应证】用于治疗细菌性结膜炎、角膜炎、角膜溃疡、泪囊炎等外眼感染。

【注意事项】(1) 不宜长期使用，以免诱发耐药菌或真菌感染。(2) 使用中如出现过敏症状，应立即停止使用。

【禁忌证】对本品或喹诺酮类药物过敏者禁用。

【不良反应】偶尔有轻微似蜇样的刺

激症状。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一日3～5次。(2) 眼用凝胶：涂于结膜囊内，一次适量，一日3次。

【制剂与规格】乳酸左氧氟沙星滴眼液：① 5 ml : 15 mg；② 8 ml : 24 mg。

盐酸左氧氟沙星眼用凝胶：5 g : 15 mg。

(其他见 9.3.14)

氧氟沙星 [基(基)、保(乙)]

Ofloxacin

【适应证】用于治疗细菌性结膜炎、角膜炎、角膜溃疡、泪囊炎、术后感染等外眼感染。

【注意事项】(1) 不宜长期使用。(2) 使用中如出现过敏症状，应立即停止使用。

【禁忌证】对本品或喹诺酮类药物过敏者禁用。

【不良反应】偶尔有辛辣似蜇样的刺激症状。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一日3～5次。(2) 眼膏：涂于结膜囊内，一次适量，一日3次。

【制剂与规格】氧氟沙星滴眼液：① 5 ml : 15 mg；② 8 ml : 24 mg。

氧氟沙星眼膏：① 2 g : 6 mg；② 3.5 g : 10.5 mg；③ 0.25 g : 0.75 mg。

(其他见 9.3.14)

诺氟沙星 [基(基)、保(乙)]

Norfloxacin

【适应证】用于敏感菌所致的外眼感染，如结膜炎、角膜炎、角膜溃疡等。

【注意事项】(1) 不宜长期使用。(2) 使用中出现过敏症状，应立即停止使用。

【禁忌证】对本品或喹诺酮类药物过敏者禁用。

【不良反应】眼部滴用后出现一过性轻微的刺激症状，如刺痛、痒和异物感。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日3～6次。

【制剂与规格】诺氟沙星滴眼液：8 ml : 24 mg。

(其他见 9.3.14)

环丙沙星 [基(基)、保(乙)]

Ciprofloxacin

【适应证】用于敏感菌引起的外眼部感染，如结膜炎等。

【注意事项】(1) 使用过程中若出现皮疹等过敏表现或其他严重不良反应，应当立即停药。(2) 哺乳期妇女慎用，用药期间应暂停哺乳。(3) 不宜用于18岁以下的小儿及青少年。(4) 老年患者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品和喹诺酮类药物过敏者。(2) 孕妇禁用。

【不良反应】(1) 偶有局部一过性刺激症状。(2) 可产生局部灼伤和异物感。(3) 眼睑水肿、流泪、畏光、视力减低、过敏反应等。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一日3～5次。(2) 眼膏：涂于结膜囊内，一次适量，一日2次。

【制剂与规格】盐酸环丙沙星滴眼液：5 ml : 15 mg (按环丙沙星计)。

乳酸环丙沙星滴眼液：8 ml : 24 mg (按环丙沙星计)。

盐酸环丙沙星眼膏：2.5 g : 7.5 mg (按环丙沙星计)。

(其他见 9.3.14)

妥布霉素 [保(乙)]

Tobramycin

【适应证】用于敏感细菌所致的外眼及眼附属器的局部感染。

【注意事项】(1) 肾功能不全、肝功能异常、前庭功能或听力减退、失水、重症肌无力或帕金森病及老年患者慎用。(2) 孕妇慎用，哺乳期妇女使用本品期间宜暂停哺乳。(3) 对一种氨基糖苷类抗生素如链霉素、庆大霉素过敏的患者，对本品也可能过敏。若出现过敏反应，应立即停药。(4) 长期应用本品可能导致耐药菌过度生长，甚至引起真菌感染。(5) 若患者同时接受氨基糖苷类抗生素的全身用药，应监测本品及氨基糖苷类抗生素的血药浓度。

【禁忌证】对本品及其他氨基糖苷类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】偶有眼局部刺激，如眼

睑发痒与红肿、结膜充血。罕见过敏反应。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，轻度及中度感染，一次1滴，4小时1次；重度感染，一次2滴，一小时1次。(2) 眼膏：①轻度及中度感染的患者，一日2～3次，一次取约1.5 cm长的眼膏涂入患眼结膜囊内，病情缓解后减量；②妥布霉素滴眼液可与眼膏联合使用，即白天滴用滴眼液，晚上使用眼膏。

【制剂与规格】妥布霉素滴眼液：5 ml : 15 mg。

妥布霉素眼膏：10 g : 50 mg。

庆大霉素[基(基). 保(甲)]

Gentamycin

【适应证】用于治疗葡萄球菌属（金黄色葡萄球菌及凝固酶阴性葡萄球菌中甲氧西林敏感株）及敏感革兰阴性杆菌，如大肠埃希菌、克雷伯杆菌属、变形杆菌属、肠杆菌属、沙雷菌属、铜绿假单胞菌等所致的结膜炎、角膜炎、泪囊炎、眼睑炎、睑板腺炎等感染。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 本品不宜长期连续使用，使用3～4日症状未缓解时，应停药就医。(3) 滴眼后出现眼部充血、水肿和眼痒时，应停药就医。

【禁忌证】对本品或其他氨基糖苷类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】滴眼后可能出现轻微刺激感。偶见过敏反应，出现眼红、眼痒和水肿等。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日3～5次。

【制剂与规格】硫酸庆大霉素滴眼液：8 ml : 4万U。

氯霉素滴眼液[基(基). 保(甲)]

Chloramphenicol Eye Drops

【适应证】用于由大肠埃希菌、流感嗜血杆菌、克雷伯杆菌属、金黄色葡萄球菌、溶血性链球菌和其他敏感菌所致的结膜炎、角膜炎、眼睑缘炎、沙眼等。

【注意事项】(1) 如使用3～4日不见症状改善，应立即停止使用并就医。(2) 出现不良反应应停止使用（出现口腔苦味为氯霉素的物理特性所致，可以继续使用）。(3) 长期使用（超过3个月）可引起视神经炎或视盘炎（特别是小儿）。长期应用本品的患者，应事先做眼部检查，并密切注意患者的视功能和视神经炎的症状，一旦出现即停药。同时服用维生素C和维生素B。(4) 孕妇及哺乳期妇女宜慎用。

【禁忌证】新生儿和早产儿禁用。

【不良反应】(1) 偶见眼睛疼痛、视力改变、持续性发红或有刺激感。(2) 口腔苦味。(3) 偶见儿童使用后出现再生不良性障碍性贫血。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一日3～5次。(2) 眼膏：涂于患眼结膜囊内，一次适量，一日3次。

【制剂与规格】氯霉素滴眼液：① 5 ml : 12.5 mg；② 8 ml : 20 mg。

氯霉素眼膏：① 2.5 g : 25 mg；② 2.5 g : 75 mg。

(其他见9.3.7)

红霉素眼膏[基(基). 保(甲)]

Erythromycin Eye Ointment

【适应证】用于沙眼、结膜炎、角膜炎、眼睑缘炎及眼外部感染。

【注意事项】(1) 用药部位如有烧灼感、瘙痒、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净。(2) 孕妇及哺乳期妇女应在医师指导下使用。(3) 避免接触其他黏膜（如口、鼻等）。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者禁用。

【不良反应】涂眼后偶见眼痛、视力改变、持性眼红或刺激症状。

【用法与用量】涂于结膜囊内：一次适量，一日2～3次，最后1次宜在睡前使用。

【制剂与规格】红霉素眼膏：1 g : 5 mg。

(其他见9.3.6)

金霉素眼膏[保(甲)]

Chlortetracycline Eye Ointment

【适应证】(1) 用于细菌性结膜炎、睑腺炎及细菌性眼睑炎。(2) 用于沙眼。

【注意事项】(1) 本品不宜长期连续使用，使用5日症状未缓解，应停药。(2) 若出现充血、眼痒、水肿等症状应停药。(3) 急性或慢性沙眼的疗程应为1～2个月或更长，眼膏可作为夜间治疗用药，以保持感染部位与药物接触较长时间。

【禁忌证】(1) 对本品或大环内酯类药物过敏者禁用。(2) 有四环素类药物过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 轻微刺激感。(2) 偶见过敏反应，出现充血、眼痒、水肿等症状。

【用法与用量】涂于患眼结膜囊内：一日1～2次，最后1次宜在睡前使用。

【制剂与规格】盐酸金霉素眼膏：1 g：5 mg。

夫西地酸滴眼液

Fusidic Acid Eye Drops

【适应证】用于急性细菌性结膜炎。

【注意事项】(1) 新生儿慎用。(2) 佩戴接触镜者用药时应先取下镜片。

【禁忌证】(1) 肝功能不全患者禁用。(2) 哺乳期妇女禁用。

【不良反应】偶见过敏反应，可有短暂性刺激感。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日2次。用药至少持续到症状消除后2日。

【制剂与规格】夫西地酸滴眼液：5 g：50 mg。

(其他见9.3.15)

利福平滴眼液[保(甲)]

Rifampicin Eye Drops

【适应证】主要用于治疗细菌性外眼感染，如沙眼、结核性眼病及某些病毒性眼病。

【注意事项】(1) 酒精中毒，肝功能不全者慎用。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 5岁以下小儿及老年人慎用。(4) 利福平可能引起白细胞和血小板减少，并导致齿龈出血和伤口愈合延迟等，此时应避免拔牙手术，刷牙及剔牙均需慎重。(5) 治疗沙眼的疗程为6周。

【禁忌证】(1) 严重肝功能不全患者禁用。(2) 胆道阻塞患者禁用。

【不良反应】(1) 滴眼后有眼局部刺激症状。(2) 可能引起白细胞和血小板减少，导致齿龈出血和感染、伤口延迟愈合等。(3) 畏寒、呼吸困难、头晕、发热、头痛、泪液呈橘红色或红棕色等。(4) 可引起皮肤发红、皮疹、瘙痒等。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日4～6次。使用前请将滴丸放入缓冲液中，振摇，使其完全溶解。

【制剂与规格】利福平滴眼液：滴丸每丸含利福平10 mg，缓冲液每瓶10 ml。

(其他见9.3.9)

复方硫酸新霉素滴眼液

Compound Neomycin Sulfate Eye Drops

【适应证】用于结膜炎、角膜炎、虹膜炎、巩膜炎、葡萄膜炎，以及白内障、青光眼、角膜移植术后及眼部机械或化学损伤处理。

【注意事项】(1) 长期频繁滴用可致眼压增高或青光眼、晶状体后囊下混浊的白内障和眼部真菌感染。(2) 角膜、巩膜溃疡者滴用后可能会引起穿孔。(3) 化脓性角膜溃疡的恢复期，应在医生指导下慎用。

【禁忌证】真菌性角膜溃疡，树枝状、地图状角膜炎禁用。

【不良反应】滴眼后有眼局部刺激症状。长期频繁滴用后可引起青光眼、白内障、眼部真菌感染。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日4～8次。

【制剂与规格】复方硫酸新霉素滴眼液：5 ml：(硫酸新霉素17.5 mg，地塞米松磷酸钠5 mg)。

四环素可的松眼膏[保(甲)]

Tetracycline and Cortisone Eye Ointment

【适应证】用于沙眼、结膜炎等眼病。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女不宜长期使用。(2) 长期频繁滴用可致青光眼、白内障和眼部真菌感染。(3) 角膜、巩膜溃疡者滴用后可能会引起穿孔。

【禁忌证】(1) 对本品及四环素类药物过敏者禁用。(2) 单纯疱疹性或溃疡性

角膜炎患者禁用。

【不良反应】长期应用可引起青光眼、白内障。

【用法与用量】涂于患眼结膜囊内：一次适量，一日 1 ～ 2 次。

【制剂与规格】四环素可的松眼膏：① 2 g，内含四环素 5 mg、醋酸可的松 5 mg；② 2.5 g，内含四环素 6.25 mg、醋酸可的松 6.25 mg。

妥布霉素地塞米松[保(乙)]

Tobramycin and Dexamethasone

【适应证】(1) 用于对糖皮质激素敏感的眼科炎性病变伴有眼部表面的细菌感染，或有感染危险的以下情况：眼睑、球结膜、角膜、眼前节组织及一些可接受糖皮质激素潜在危险性的感染性结膜炎等炎性疾病，可以减轻水肿和炎症反应。(2) 用于慢性前葡萄膜炎。(3) 用于化学性、放射性、灼伤性及异物穿透所致的角膜病变。

【注意事项】(1) 对其他氨基糖苷类抗生素过敏的患者对本品也有可能过敏。如果用药后发生过敏反应，应当停用。(2) 2 岁以下儿童慎用。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 长期滴用后，可致青光眼、白内障或眼部真菌感染。使用过程中应当监测眼压。(5) 长期滴用可能掩盖或加重已有的感染，以及增大眼部继发严重感染的机会。(6) 在一些导致角膜、巩膜变薄的病变中可能会引起眼球穿孔。

【禁忌证】(1) 单纯疱疹病毒性角膜炎，牛痘、水痘及一些因病毒感染引起的角膜和结膜疾患，眼部分枝杆菌感染，眼部真菌感染患者禁用。(2) 对本品或氨基糖苷类药物过敏者禁用。(3) 角膜异物未完全去除的患者禁用。

【不良反应】(1) 滴眼后可以出现眼睑刺痒、水肿、结膜充血。(2) 眼压升高，并可能导致青光眼，偶尔有视神经的损害、晶状体后囊膜下白内障形成和伤口愈合延迟。(3) 长期使用后极易发生角膜真菌感染，也可能导致继发眼部细菌感染。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼；一次 1 滴，每 4 ～ 6 小时用 1 次。在用药的最初 1 ～ 2 日可增加至每 2 小时 1 次。根据临床症状的改善状况逐渐减少用药的频度，注意不要过早停止治疗。(2) 眼膏：涂于结膜囊内；一次适量（长 1 ～ 1.5 cm），一日 3 ～ 5 次。

【制剂与规格】妥布霉素地塞米松滴眼液：5 ml，内含妥布霉素 15 mg、地塞米松 5 mg。

妥布霉素地塞米松眼膏：① 3.5 g：妥布霉素 10.5 mg，地塞米松 3.5 mg；② 3 g：妥布霉素 9 mg，地塞米松 3 mg。

硫酸庆大霉素氟米龙滴眼液[保(乙)]

Gentamicin Sulfate and Fluorometholone Eye Drops

【适应证】(1) 用于对庆大霉素敏感细菌引起的眼前节细菌性感染，如细菌性结膜炎。(2) 用于眼前段炎症，以及有发生细菌性感染危险的治疗，如眼部手术等。

【注意事项】(1) 长期频繁滴用可致青光眼、白内障和继发性眼部真菌感染。(2) 长期使用本品治疗可能会导致角膜和巩膜变薄。(3) 长期使用本品治疗，可能会增加继发性真菌或非易感细菌感染，故使用本品请勿超过 2 周。(4) 内眼手术后立即使用本品，可能延缓伤口的愈合。(5) 角膜接触镜戴用者务必在使用前取下，用药 5 分钟后再戴上。若发生眼部感染，则应停戴角膜接触镜数日，以防感染蔓延。(6) 若使用本品 7 ～ 8 日，病情未见改善，应停用，可考虑改用其他疗法。

【禁忌证】(1) 对本品所含成分过敏者禁用。(2) 角膜损伤或溃疡患者禁用。(3) 病毒感染（如单纯疱疹病、牛痘）或真菌病患者禁用。(4) 眼结核及青光眼患者禁用。

【不良反应】(1) 偶有短暂的灼热感等局部刺激症状。(2) 罕见发痒、发热等过敏反应。

【用法与用量】(1) 细菌性感染：滴眼，一次 1 滴，一日 5 次；严重者可在 1 ～ 2 日内每小时一次。(2) 眼科手术后治疗：滴眼，第一周，一次 1 滴，一日 4 次；之后再依治疗情况酌减使用次数。

【制剂与规格】硫酸庆大霉素氟米龙滴眼液：5 ml，内含硫酸庆大霉素 1.5 万 U、氟米龙 5 mg。

13.2.2 抗真菌药

很多种类的真菌都能引起眼部感染，如真菌性角膜炎、真菌性眼内炎和眼眶真菌感染。可以通过实验室检查来鉴别真菌菌种。

真菌性角膜炎通常采用滴眼液滴眼治疗，有时需要合并全身用药。对于真菌性眼内炎，可以采取多种途径进行治疗，如结膜下注射、前房内注射、玻璃体腔内注射和全身用药等，如向玻璃体腔内注入两性霉素 B 0.005 ~ 0.001 mg/0.1 ml。

两性霉素 B、那他霉素具有广谱抗真菌活性，是治疗眼部真菌感染可供选择的药物。其他具有抗真菌活性的药物有酮康唑、氟康唑、伊曲康唑、伏立康唑等。

给药方法：(1) 滴眼液：一次 1 滴，至少每 2 小时 1 次。感染控制后减少滴药频次。痊愈后持续用药 48 小时。(2) 眼膏：如果白天滴用滴眼液，则涂用眼膏每晚 1 次。如果只用眼膏，一日 3 ~ 4 次。

那他霉素滴眼液[保(乙)]

Natamycin Eye Drops

【适应证】用于对本品敏感的真菌性眼睑炎、结膜炎和角膜炎，包括腐皮镰刀菌角膜炎。

【注意事项】(1) 如果使用本品 7 ~ 10 日后，角膜炎仍无好转，则提示引起感染的微生物对本品不敏感，应根据临床情况和实验室其他检查结果决定是否继续治疗。(2) 孕妇和哺乳妇女慎用。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】滴眼后有可能引起过敏反应，导致球结膜水肿和充血。

【用法与用量】(1) 治疗真菌性角膜炎：滴眼，初始一次 1 滴，每 1 ~ 2 小时 1 次；3 ~ 4 日后改为一次 1 滴，一日 6 ~ 8 次，连用 14 ~ 21 日，或者一直持续到活动性真菌性角膜炎消退。(2) 治疗真菌性眼睑炎和结膜炎：滴眼，初始一次 1 滴，一日 4 ~ 6 次，连用 14 ~ 21 日，或者一直持续到活动性真菌性角膜炎消退。

【制剂与规格】那他霉素滴眼液：15 ml : 750 mg。

氟康唑滴眼液[保(乙)]

Fluconazole Eye Drops

【适应证】用于治疗白色念珠菌、烟曲霉菌、隐球菌及球孢子菌属等引起的真菌性角膜炎。

【注意事项】(1) 对其他咪唑类药物过敏者，对本品也可能过敏。(2) 肝、肾功能严重障碍者慎用。(3) 不推荐儿童使用。(4) 重度真菌性角膜炎应以全身抗真菌治疗为主，本品局部治疗为辅。(5) 用药前需要眼科专科医师诊治，确定是否需要局部清创处理。(6) 使用过程中发现异常，应立即停药。

【禁忌证】(1) 对本品或其他三唑类、吡咯类药物过敏者禁用。(2) 妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】偶见眼部刺激反应和过敏反应。

【用法与用量】滴眼：一次 1 ~ 2 滴，一日 4 ~ 6 次，重症每 1 ~ 2 小时 1 次。

【制剂与规格】氟康唑滴眼液：① 5 ml : 25 mg；② 8 ml : 40 mg。

(其他见 9.7.3.10)

13.2.3 抗病毒药

腺病毒可致流行性角结膜炎，微小核糖核酸病毒可致传染性极强的急性出血性结膜炎。单纯疱疹病毒可致结膜炎和角膜炎，巨细胞病毒可致巨细胞病毒性视网膜炎。一些病毒的眼部感染会产生严重视力障碍，甚至失明，如单纯疱疹病毒性角膜炎、巨细胞病毒性视网膜炎。可以应用利巴韦林、阿昔洛韦、更昔洛韦治疗单纯疱疹病毒性眼部感染，应用羟苄唑治疗病毒性结膜炎，应用阿昔洛韦、更昔洛韦进行全身治疗或玻璃体腔内注射来治疗急性视网膜坏死综合征。

利巴韦林[保(甲)]

Ribavirin

【适应证】用于单纯疱疹病毒性角膜炎。

【注意事项】(1) 严重贫血、肝功能不全者慎用。(2) 哺乳期妇女应用时应暂停授乳。(3) 若长期大量使用本品可能会

产生与全身用药相似的不良反应，如肝功能和血象的异常。(4) 本品不宜用于其他病毒性眼病。

【禁忌证】孕妇禁用。

【不良反应】偶见眼部轻微的刺激症状。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一小时1次，病情好转后每2小时1次。(2) 眼膏：涂于患眼结膜囊内，一次适量，一日2～4次。

【制剂与规格】利巴韦林滴眼液：① 0.8 ml：0.8 mg；② 8 ml：8 mg。

利巴韦林眼膏：① 2 g：8 mg；② 2.5 g：12.5 mg。

(其他见9.6.1.2)

阿昔洛韦[基(基)，保(甲)]

Aciclovir

【适应证】用于单纯疱疹性角膜炎。

【注意事项】滴眼液中如有结晶或粉末状物析出，温热溶解后使用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见眼局部轻微疼痛和烧灼感。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，每2小时1次。(2) 眼膏：涂于结膜囊内，一次适量，一日4～6次。

【制剂与规格】阿昔洛韦滴眼液：8 ml：8 mg。

阿昔洛韦眼膏：2 g：60 mg。

(其他见9.6.3)

更昔洛韦[保(乙)]

Ganciclovir

【适应证】用于单纯疱疹病毒性角膜炎。

【注意事项】(1) 儿童慎用。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 精神病患者及神经中毒症状者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者禁用。(2) 严重中性粒细胞减少（少于 0.5×10^9/L）或严重血小板减少（少于 25×10^9/L）者禁用。

【不良反应】滴眼后可以发生短暂的眼痒、灼热感、针刺感和轻微的视物模糊。偶见白细胞下降。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，每2小时1次。(2) 眼膏：涂于结膜囊内，一次适量（长5～6 mm含更昔洛韦0.25～0.30 mg），一日4～6次。(3) 眼用凝胶：一次1滴，一日4次，疗程3周。

【制剂与规格】更昔洛韦滴眼液：8 ml：8 mg。

更昔洛韦眼膏：2 g：20 mg。

更昔洛韦眼用凝胶：5 g：7.5 mg。

(其他见9.6.3)

羟苄唑滴眼液[保(甲)]

Hydrobenzole Eye Drops

【适应证】用于急性流行性出血性结膜炎。

【注意事项】本品需防止阳光直射。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】滴眼后可有轻度的刺激性。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一小时1～2次。病情严重者一小时3～4次。

【制剂与规格】盐酸羟苄唑滴眼液：① 0.8 ml：0.8 mg；② 8 ml：8 mg。

13.3 眼用抗炎药

13.3.1 糖皮质激素

眼部炎症是一种重要的病症，累及眼附属器、眼前节和眼后节等各个部位，可以产生严重的后果。糖皮质激素局部给药，如使用滴眼液、眼膏，结膜下注射或眼内注射给药是控制眼部炎症（包括手术引起的炎症）的重要措施。全身应用，例如口服糖皮质激素对一些眼部病变是有益的。

糖皮质激素和抗感染药物的复合制剂有时用于眼科手术后，以便减少炎症反应和预防感染。除此之外，这种复合制剂的应用几乎都是不合理的。

应用糖皮质激素存在3个主要危险：①加重病毒性、细菌性、真菌性和阿米巴原虫眼部感染的病情，导致角膜溃疡，损伤视力，甚至失明。②易感个体中眼局部应用糖皮质激素制剂可能会继发糖皮质激素性青光眼。③长期使用糖皮质激素可能继发糖皮质激素性白内障，其风险随着用

药剂量和持续时间的增加而增加。眼局部应用糖皮质激素的其他不良反应还包括角膜和巩膜变薄。

泼尼松龙滴眼液[保(乙)]

Prednisolone Eye Drops

【适应证】(1) 用于需要抗炎治疗的眼部疾病，如非化脓性结膜炎、睑炎、巩膜炎、非疱疹性角膜炎、泪囊炎。(2) 用于在眼科手术后、异物去除后、化学或热烧伤、擦伤、裂伤或其他眼部创伤时做预防性治疗。

【注意事项】(1) 长期用药后若出现眼部慢性炎症的表现，应考虑角膜真菌感染的可能。(2) 如果发生双重感染，应立即停药并进行适当的治疗。(3) 孕妇及儿童慎用。

【禁忌证】(1) 未行抗感染治疗的急性化脓性眼部感染患者禁用。(2) 急性单纯疱疹病毒性角膜炎、角膜及结膜的病毒感染、眼部结核、眼部真菌感染患者禁用。(3) 牛痘、水痘等感染性疾病患者禁用。

【不良反应】(1) 继发眼部的真菌和病毒感染。在一些角膜及巩膜变薄的患者长期使用时，还可导致眼球穿孔。(2) 有单纯疱疹病毒性角膜炎病史患者、急性化脓性感染患者慎用。(3) 长期应用本品可能导致非敏感菌过度生长。(4) 长期或大剂量眼部使用本品可导致后囊膜下白内障。(5) 本品可引起眼压升高，从而导致视神经的损害和视野的缺损，因此建议使用该药期间应定期测量眼压。

【用法与用量】滴眼：一次 1 ~ 2 滴，一日 2 ~ 4 次。开始治疗的 24 ~ 48 小时，剂量可酌情增大至一小时 2 次，必要时可加大用药频率。不宜中途终止治疗，应逐步减量停药。

【制剂与规格】醋酸泼尼松龙滴眼液：5 ml : 50 mg。

(其他见 5.4.4.2)

氟米龙滴眼液[保(乙)]

Fluorometholone Eye Drops

【适应证】用于对糖皮质激素敏感的外眼、眼前节组织的炎症，如睑结膜炎、球结膜炎、角膜炎等。

【注意事项】(1) 对孕妇或可能妊娠的妇女应避免长期、频繁用药。(2) 对未满 2 周岁的婴幼儿应慎重用药。(3) 长期使用可导致角膜真菌感染。(4) 单纯疱疹病毒感染病史者慎用。(5) 多种眼部疾病及局部长期使用可能导致角膜和虹膜变薄，这种情况下，局部使用可能引起穿孔。(6) 未经抗菌治疗的眼部急性化脓性感染，用本品可能掩盖病情或使病情恶化。(7) 用药期间应定期测量眼压。

【禁忌证】(1) 角膜上皮剥脱或角膜溃疡患者禁用。(2) 病毒性结膜、角膜病变患者禁用。(3) 结核性、真菌性或化脓性眼病患者禁用。

【不良反应】可能引起眼压升高，甚至青光眼，偶致视神经损害。可能会引起晶状体后囊膜下白内障、继发性感染，眼球穿孔和延缓伤口愈合。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 2 ~ 4 次。开始治疗的 24 ~ 48 小时可以酌情增至一小时 2 次，或根据患者年龄、病情适当增减。应逐步减量停药。

【制剂与规格】氟米龙滴眼液：① 5 ml : 5 mg；② 10 ml : 10 mg。

可的松[基(基)，保(甲)]

Cortisone

【适应证】用于虹膜睫状体炎、虹膜炎、角膜炎、过敏性结膜炎等。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女不宜频繁、长期使用。(2) 青光眼患者应在眼科医师指导下使用。(3) 本品不宜长期滴用，一般连续不得超过 2 周，若症状未缓解应停药就医。(4) 眼部细菌性或病毒性感染时应与抗菌药物合用。

【禁忌证】单纯疱疹性或溃疡性角膜炎禁用。

【不良反应】长期频繁用药可引起青光眼、白内障。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次。用前摇匀。(2) 眼膏：涂于结膜囊内，一次适量，一日 1 次，睡前用。

【制剂与规格】醋酸可的松滴眼液：3 ml : 15 mg。

醋酸可的松眼膏：① 1 g : 5 mg；

② 1 g : 2.5 mg。

地塞米松滴眼液[保(甲)]

Dexamethasone Eye Drops

【适应证】用于虹膜睫状体炎、虹膜炎、角膜炎、过敏性结膜炎、眼睑炎、泪囊炎等。

【注意事项】(1) 青光眼患者慎用。(2) 眼部细菌性或病毒性感染时应与抗生素药物合用。(3) 长期使用应定期检查眼压和有无真菌、病毒感染早期症状。

【禁忌证】单纯疱疹性或溃疡性角膜炎禁用。

【不良反应】长期频繁用药可引起青光眼、白内障，诱发真菌性眼睑炎。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】地塞米松磷酸钠滴眼液：5 ml : 1.25 mg。

(其他见 5.4.4.2)

氟甲松龙（氟米龙）[保(乙)]

Fluorometholone

【适应证】用于对皮质激素敏感的眼前段组织炎症的治疗，如葡萄膜炎、巩膜炎、疱疹性结膜炎、虹膜炎、虹膜睫状体炎等及 PK、PRK 术后的抗炎治疗。

【注意事项】孕妇及 2 岁以下儿童慎用。用药期间应监测眼压，防止二重感染，对于急性化脓性感染，应予以适当的抗菌治疗。

【禁忌证】对本药过敏及患有角膜溃疡、病毒性角结膜炎、结核性眼部疾病，真菌性眼部疾病及化脓性眼科疾病患者禁用。

【不良反应】长期应用可使眼内压升高或导致青光眼，并伴有视神经损伤、视力下降及视野缺损，也可能出现角膜穿孔，后囊膜下白内障及一些刺激症状，眼部继发性感染等。

【用法与用量】在治疗初期（24 ~ 48 小时内），滴眼一次 1 ~ 2 滴，2 小时 1 次，以后一日 4 次。

【制剂与规格】氟甲松龙（氟米龙）滴眼液：1%。

氯替泼诺滴眼液

Loteprednol Eye Drops

【适应证】(1) 0.2%的滴眼液用于季节性过敏性结膜炎的治疗。(2) 0.5%的滴眼液用于眼睑和球结膜、角膜和眼前节的糖皮质激素敏感的炎症的治疗，如过敏性结膜炎、泡性结角膜炎、浅层点状角膜炎、带状疱疹性角膜炎、虹膜炎、睫状体炎、选择性感染性结膜炎。本品也适用于眼科手术后炎症的治疗。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 未满 2 周岁的婴幼儿慎用。(3) 长期使用可能增加眼部继发感染的危险，长期局部应用尤其容易发生角膜的真菌感染。(4) 长期应用可能导致青光眼、视野缺损及晶状体后囊膜下白内障的形成。(5) 如用药 2 日后症状体征无改善，应接受检查。

【禁忌证】结膜或角膜的病毒、真菌或支原体感染患者禁用。

【不良反应】(1) 视物模糊、烧灼感、球结膜水肿、分泌物、干眼、溢泪、异物感、眼痒、刺痛、畏光等。(2) 结膜炎、角膜异常、眼睑发红、角膜炎、巨乳头性结膜炎和葡萄膜炎等。(3) 眼外的不良反应包括头痛、鼻炎和咽炎。

【用法与用量】(1) 0.2% (Alrex)：滴眼，一次 1 滴，一日 4 次。(2) 0.5% (Lote-max)：滴眼，一次 1 滴，一日 4 次；治疗的第 1 周，如果必要时，剂量可以增加到一小时 1 次。用于手术后炎症控制时，滴入术眼的结膜囊内，一次 1 滴，一日 4 次，在术后 24 小时就开始使用，并必须持续使用至术后 2 周。

【制剂与规格】氯替泼诺滴眼液：(1) 0.2% (Alrex)，5 ml : 10 mg。(2) 0.5% (Lote-max)：① 2.5 ml : 12.5 mg；② 5 ml : 25 mg；③ 10 ml : 50 mg。

13.3.2 其他抗炎药

非甾体抗炎药物可以用于预防白内障手术时瞳孔缩小和术后炎症，在术前应用会获得更佳的效果。长期局部应用这类药物不会引起继发性青光眼、白内障、延缓伤口愈合、诱发感染等糖皮质激素那样的

严重不良反应。

其他用于炎症和过敏性结膜炎治疗的制剂有抗组胺药依美斯汀、奥洛他定等。肥大细胞稳定剂色甘酸钠可以用于治疗春季结角膜炎及其他过敏性结膜炎。洛度沙胺滴眼液用于治疗过敏性结膜炎，包括季节性过敏性结膜炎。双氯芬酸滴眼液也可以治疗季节性过敏性结膜炎。

双氯芬酸钠滴眼液[保(乙)]

Diclofenac Sodium Eye Drops

【适应证】(1) 用于治疗葡萄膜炎、角膜炎、巩膜炎、抑制角膜新生血管的形成。(2) 用于治疗内眼手术后、激光小梁成形术后或各种眼部损伤的炎症反应。(3) 抑制白内障手术中缩瞳反应。(4) 用于准分子激光角膜切削术后止痛及消炎。(5) 用于春季结膜炎。(6) 预防和治疗白内障摘除及人工晶状体植入术后炎症反应及黄斑囊样水肿。(7) 青光眼滤过术后促进滤过泡形成等。

【注意事项】(1) 孕妇慎用。(2) 本品可妨碍血小板聚集，有增加眼组织术中或术后出血的倾向。

【禁忌证】戴角膜接触镜者禁用，但角膜屈光手术后暂时佩戴治疗性亲水软角膜接触镜者除外。

【不良反应】滴眼后有短暂烧灼、刺痛、流泪等。极少数人可有结膜充血、视物模糊。少数人出现乏力、困倦、恶心等全身反应。

【用法与用量】(1) 一般适应证：滴眼，一次 1 滴，一日 4 ~ 6 次。(2) 眼科手术：滴眼，一次 1 滴，术前 3、2、1 和 0.5 小时内各用 1 次。(3) 白内障摘除术：滴眼，术后 24 小时开始用药，一次 1 滴，一日 4 次，持续 2 周。(4) 角膜屈光术：滴眼，术后 15 分钟即可用药，一次 1 滴，一日 4 次，持续用药 3 日。

【制剂与规格】双氯芬酸钠滴眼液：① 0.4 ml : 0.4 mg；② 1 ml : 1 mg；③ 5 ml : 5 mg。

氟比洛芬钠滴眼液

Flurbiprofen Sodium Eye Drops

【适应证】(1) 用于术后抗炎，治疗激光小梁成形术后炎症反应以及其他眼前节炎症。(2) 用于预防和治疗白内障摘除和人工晶状体植入术后的黄斑囊样水肿。(3) 用于治疗巨乳头性结膜炎。(4) 用于抑制内眼手术中的瞳孔缩小。

【注意事项】(1) 不推荐妊娠及哺乳期妇女使用本品。(2) 有单纯疱疹病毒性角膜炎病史者，慎用本药。(3) 本品可能影响血小板聚集而延长出血时间，有出血倾向或服用其他使出血时间延长药物者慎用。(4) 对阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏者，对本品也可能过敏。(5) 急性眼部感染疾病在局部使用抗炎药时，可能掩盖病情。(6) 本品无抗菌作用，对眼部感染性疾病，应同时应用抗生素。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】有短暂烧灼、刺痛或其他轻微刺激症状。

【用法与用量】(1) 抑制内眼手术时的瞳孔缩小：术前 2 小时开始滴眼，一次 1 滴，每半小时滴 1 次，共 4 次。(2) 消炎和术后消炎：滴眼，一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次，连用 2 ~ 3 周。(3) 激光小梁成形术：术后滴眼，一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次，连用 1 ~ 2 周。

【制剂与规格】氟比洛芬钠滴眼液：① 5 ml : 1.5 mg；② 10 ml : 3 mg。

普拉洛芬[保(乙)]

Pranoprofen

【适应证】用于眼睑炎、结膜炎、角膜炎、巩膜炎、浅层巩膜炎、虹膜睫状体炎、术后炎症等外眼及眼前节炎症的对症治疗。

【注意事项】(1) 本品只用于对症治疗而不是对因治疗。(2) 本品可能掩盖眼部感染，对于感染引起的炎症使用本品时，一定要仔细观察，慎重使用。

【禁忌证】对本品的成分有过敏史的患者禁用。

【不良反应】刺激感、结膜充血、瘙痒感、眼睑发红和肿胀、眼睑炎、分泌物、流泪、弥漫性表层角膜炎、异物感、结膜水肿。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 4 次，根据症状可以适当增减次数。

【制剂与规格】普拉洛芬滴眼液：5 ml : 5 mg。

酮咯酸氨丁三醇滴眼液

Ketorolac Tromethamine Eye Drops

【适应证】(1) 用于暂时缓解季节性过敏性结膜炎引起的眼痒。(2) 用于治疗内眼手术后（如白内障摘除术）的炎症反应。

【注意事项】(1) 对阿司匹林、苯乙酸衍生物及其他非甾体抗炎药过敏者，对本品也可能过敏。(2) 慎用于有出血倾向的患者，或避免合并应用可能延长出血时间的药物。(3) 使用本品感觉不适时，应立即停药。(4) 避免在佩戴软性角膜接触镜时用药。

【禁忌证】(1) 患有活动性消化性溃疡、近期出现过胃肠道出血或穿孔的患者，或有消化性溃疡和胃肠道出血病史的患者禁用。(2) 肾功能不全，或因血容不足而有肾衰竭危险的患者禁用。(3) 临产、分娩及产妇禁用。(4) 对酮咯酸氨丁三醇有过敏史或对阿司匹林和其他非甾体抗炎药过敏的患者禁用。(5) 本品禁用于手术疼痛的预防或手术中镇痛。(6) 可疑或确诊有脑血管出血、不完全止血和高危出血的患者禁用。

【不良反应】一过性刺痛或灼热感、过敏反应、眼刺激、浅层眼部感染及浅层角膜炎、角膜水肿、眼干、视物模糊、角膜溃疡、头痛、充血等。

【用法与用量】(1) 过敏性结膜炎：滴眼，一次 1 滴，一日 3 次。(2) 眼科术后炎症：滴眼，手术前 24 小时开始滴用，一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次，术后继续用 2 周。

【制剂与规格】酮咯酸氨丁三醇滴眼液：5 ml : 25 mg。

富马酸依美斯汀滴眼液 [保（乙）]

Emedastine Difumarate Eye Drops

【适应证】用于治疗过敏性结膜炎。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 使用本品时勿佩戴角膜接触镜。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】头痛、异梦、乏力、怪味、视物模糊、眼部灼热或刺痛、角膜浸润、角膜着染、皮炎、不适、眼干、异物感、充血、角膜炎、瘙痒、鼻炎、鼻窦炎和流泪。有些表现与疾病本身的症状相似。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 2 次，必要时一日 4 次。

【制剂与规格】富马酸依美斯汀滴眼液：5 ml : 2.5 mg。

洛度沙胺滴眼液

Lodoxamide Eye Drops

【适应证】(1) 用于各种过敏性眼病，如春季角结膜炎、卡他性结膜炎、巨大乳头性睑结膜炎、过敏性或特异反应性角结膜炎，包括那些病因不明但一般由空气传播的抗原及角膜接触镜引起的过敏反应。(2) 用于由 I 型速发性变态反应（或肥大细胞）引起的炎症性眼病。

【注意事项】(1) 用药物时勿佩戴角膜接触镜，需等数小时后方可佩戴。(2) 用药次数勿任意增加。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 用药后症状改善（如痒感、异物感、畏光、刺痛、流泪、发红及肿胀等）通常需数日，有时需持续治疗达 4 周。用药后若症状减轻，应坚持用药至进一步改善，必要时可与糖皮质激素类药物同用。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者禁用。

【不良反应】轻微短暂的眼部不适感，如灼热、刺痛、眼痒、流泪。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 4 次。

【制剂与规格】洛度沙胺滴眼液：5 ml : 5 mg。

奥洛他定滴眼液

Olopatadine Eye Drops

【适应证】用于治疗过敏性结膜炎的体征和症状。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 使用本品时，勿佩戴角膜接触镜。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】头痛、乏力、视物模糊、烧灼或刺痛感、感冒综合征、眼干、异物

感、充血、过敏、角膜炎、眼睑水肿、恶心、咽炎、瘙痒、鼻炎、鼻窦炎及味觉倒错。相当一部分的不良反应和疾病本身的症状相似。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日2次。

【制剂与规格】奥洛他定滴眼液：5 ml : 5 mg。

吡嘧司特钾滴眼液

Pemirolast Potassium Eye Drops

【适应证】用于过敏性结膜炎、春季结膜炎。

【注意事项】滴眼时如果药液粘到眼睑、皮肤等处时，应马上拭去。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】眼刺激感、眼睑炎、眼部分泌物、结膜充血、眼睑痛痒感等。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日2次。

【制剂与规格】吡嘧司特钾滴眼液：5 ml : 5 mg。

色甘酸钠滴眼液[保(乙)]

Sodium Cromoglicate Eye Drops

【适应证】用于预防春季结膜炎。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 严重肝、肾功能不全患者慎用。(3) 用药前应清洁鼻腔。(4) 在春季结膜炎好发季节前2～3周使用。

【禁忌证】妊娠3个月以内的妇女禁用。

【不良反应】滴眼后偶有刺痛感和过敏反应。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日4次，必要时一日6次。

【制剂与规格】色甘酸钠滴眼液：① 8 ml : 0.16 g；② 0.8 ml : 16 mg。

(其他见2.5.1)

马来酸非尼拉敏盐酸萘甲唑啉滴眼液

Pheniramine Maleate Naphazoline Hydrochloride Eye Drops

【适应证】用于缓解因尘埃、感冒、过敏、揉眼、佩戴角膜接触镜、游泳以及眼睛疲劳等引起的眼部充血、瘙痒、灼热感以及其他刺激症状。

【注意事项】(1) 本品连用3～4日，症状未缓解者应停药就医。(2) 患有严重心血管疾病的老年患者、孕妇和哺乳期妇女以及未控制好的高血压、糖尿病患者慎用。(3) 在使用过程中，如发现眼红、疼痛等情况，应停药就医。(4) 佩戴角膜接触镜时滴药前摘下，滴药后15分钟再戴上。(5) 过敏体质者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者禁用。(2) 闭角型青光眼患者禁用。

【不良反应】(1)偶见滴眼后瞳孔散大，眼压升高。(2) 长期使用可能产生全身反应，如高血压、心律失常及高血糖等，停药后可恢复。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，每3～4小时1次。可根据症状缓解情况减少滴药次数。

【制剂与规格】马来酸非尼拉敏盐酸萘甲唑啉滴眼液：15 ml：(马来酸非尼拉敏45 mg，盐酸萘甲唑啉3.75 mg)。

普罗碘铵[保(甲)]

Prolonium Iodide

【适应证】用于晚期肉芽肿或非肉芽肿性虹膜睫状体炎、视网膜脉络膜炎，眼底出血、玻璃体混浊、半陈旧性角膜白斑、斑翳，亦可作为视神经炎的辅助治疗。

【注意事项】(1) 因本品能刺激组织水肿，一般不用于病变早期。(2) 不得与甘汞制剂合并使用，以防生成碘化高汞毒性物。(3) 本品使用期限一年，如期满物理性状无变化，游离碘检查合格，可继续使用。(4) 甲状腺肿大及有甲状腺功能亢进家族史者慎用。

【禁忌证】(1) 对碘过敏者禁用。(2) 严重肝肾功能损害、活动性肺结核、消化道溃疡隐性出血者禁用。

【不良反应】久用可偶见轻度碘中毒症状，如恶心、发痒、皮肤红疹等。出现症状时可暂停使用或少用。

【用法与用量】(1) 结膜下注射：一次0.1～0.2 g，2～3日1次，5～7次为1个疗程。(2) 肌内注射：一次0.4 g，一日或隔日1次，10次为1个疗程，每

疗程间隔7～14日，一般用2～3个疗程。

【制剂与规格】普罗碘铵注射液：2 ml ：0.4 g。

13.4 散瞳药和睫状肌麻痹药

散大瞳孔是眼科常用的治疗。抗M胆碱类药物能够散大瞳孔，麻痹睫状肌。不同药物具有不同效能和作用持续时间。作用时间短、作用相对弱的散瞳剂，如0.5%托吡卡胺滴眼液可以用于眼底检查。1%阿托品滴眼液可以引起睫状肌麻痹，适用于青少年的屈光检查。涂用眼膏可以减少药物的全身吸收，因此1%阿托品眼膏更适合于5岁以下儿童。具有较长作用时间的阿托品也可用于治疗前葡萄膜炎，主要是防止瞳孔缘虹膜后粘连。1%后马托品作用时间较短，可以作为治疗眼前节炎症的首选药物。

α肾上腺素受体激动药去氧肾上腺素具有散大瞳孔的作用，但没有睫状肌麻痹作用。10%去氧肾上腺素滴眼液经常与1%阿托品滴眼液合用，以便增强散瞳作用。但10%去氧肾上腺素滴眼液禁用于新生儿、儿童及患有心脏病的老年人，只能用2.5%的浓度。

(1) 注意事项：①深色虹膜用药后瞳孔不易散大。要注意避免滴用的药物过量。②散瞳可以诱发少数患者发生急性闭角型青光眼，他们通常有浅前房。③去氧肾上腺素与全身给予的单胺氧化酶抑制药有药物相互作用。④滴药后压迫泪囊部2～3分钟，以免药物经鼻腔吸收而中毒。⑤应当提醒开车的患者在散瞳后1～2小时不要开车。

(2) 不良反应：①散瞳剂和睫状肌麻痹药剂的眼部不良反应包括一过性针刺感和眼压升高。②长时间用药会引起眼局部刺激、充血、水肿和结膜炎。③应用抗M胆碱类散瞳剂，特别是阿托品，可以导致接触性睑皮肤炎。④长期应用阿托品会发生一些全身的不良反应，如皮肤和黏膜干燥、发热、激动和谵妄、心动过速、脸部潮红等。

(3) 散瞳药和睫状肌麻痹药分类：包括3类：①抗胆碱药及抗毒蕈碱药（硫酸阿托品、环喷托酯、后马托品和托吡卡胺）；②拟交感神经药（去氧肾上腺素）；③抗M胆碱药和拟交感神经药复合制剂（复方托吡卡胺）。

硫酸阿托品 [基(基)，保(甲)]

Atropine Sulfate

【适应证】(1) 用于眼底检查及验光前的睫状肌麻痹，眼科手术前散瞳，术后防止粘连。(2) 用于治疗角膜炎、虹膜睫状体炎。

【注意事项】(1) 阿托品类散瞳药对正常眼压无明显影响，但对眼压异常或窄前房角、浅前房的患者，应用后可使眼压明显升高而有激发青光眼急性发作的危险。故对这类病例和40岁以上的患者不用阿托品滴眼。(2) 滴眼后用手指压迫泪囊部1～2分钟，减少药液的全身吸收。(3) 孕妇慎用，哺乳期妇女应避免使用或停止哺乳。(4) 老年患者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者禁用。(2) 青光眼及前列腺肥大者禁用。(3) 儿童脑外伤者禁用。

【不良反应】(1)用药后可能产生皮肤、黏膜干燥，发热，面部潮红，心动过速等。(2) 少数人出现眼睑发痒、红肿，结膜充血等过敏表现。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一日3次，或病情需要时用。(2) 眼用凝胶：涂于结膜囊内，一次1滴，一日2次，或病情需要时用。(3) 眼膏：涂于结膜囊内，一次适量，每晚1次，或病情需要时用。

【制剂与规格】硫酸阿托品滴眼液：10 ml：100 mg。

硫酸阿托品眼用凝胶：2.5 g：25 mg。

硫酸阿托品眼膏：2 g：20 mg。

氢溴酸后马托品滴眼液 [保(乙)]

Homatropine Hydrobromide Eye Drops

【适应证】用于12岁以上40岁以下患者的睫状肌麻痹下验光和眼底检查。

【注意事项】(1) 滴时按住内眦部，以免流入鼻腔，吸收而中毒。(2) 前列腺肥大患者慎用。(3) 40岁以上患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏和青光眼患者禁用。

【不良反应】不良反应主要由于滴眼后吸收进入体内所致，因此滴眼时需压迫内眦以防止药物流入鼻腔而吸收。不良反应的表现为共济失调、兴奋不安、幻觉等。其余不良反应和注意事项同硫酸阿托品。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，每 10 分钟 1 次，连用 1 小时。

【制剂与规格】氢溴酸后马托品滴眼液：① 10 ml ∶ 100 mg；② 5 ml ∶ 100 mg。

环喷托酯滴眼液

Cyclopentolate Eye Drops

【适应证】用于散瞳和调节麻痹。

【注意事项】(1) 婴幼儿和强直性麻痹或脑损伤患者使用本品后易出现全身不良反应，因此用药浓度应低于 0.5%。(2) 不良反应主要由于滴眼后吸收进入体内所致，因此滴眼时需压迫内眦以防止药物流入鼻腔而吸收。(3) 40 岁以上患者慎用。

【禁忌证】青光眼患者禁用。

【不良反应】(1) 眼部：用药后可产生烧灼感，可使青光眼患者的眼压升高。(2) 全身：滴眼后可能引起儿童中枢神经系统的紊乱，如运动失调、幻视和语无伦次。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 1 次，或遵医嘱。

【制剂与规格】盐酸环喷托酯滴眼液：① 5 ml ∶ 25 mg；② 5 ml ∶ 50 mg；③ 15 ml ∶ 150 mg。

托吡卡胺滴眼液[保(甲)]

Tropicamide Eye Drops

【适应证】用于散瞳和调节麻痹。

【注意事项】(1) 为避免药物经鼻黏膜吸收，滴眼后应压迫泪囊部 2 ～ 3 分钟。(2) 如出现口干、颜面潮红等阿托品样毒性反应应立即停用，必要时给予拟胆碱类药物解毒。(3) 婴幼儿对本品的不良反应极为敏感，药物吸收后可引起眼局部皮肤潮红、口干等。(4) 老年患者容易产生类阿托品样毒性反应，也有可能诱发未经诊断的闭角型青光眼，一经发现应即停药。

【禁忌证】(1) 闭角型青光眼患者禁用。(2) 婴幼儿有脑损伤、痉挛性麻痹及先天愚型综合征反应强烈患者禁用。

【不良反应】(1) 1% 溶液可能产生暂时的刺激症状。(2) 散瞳期间视物模糊，可使闭角型青光眼眼压急剧升高，也可能激发未被诊断的闭角型青光眼。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，间隔 5 分钟滴第 2 次。

【制剂与规格】托吡卡胺滴眼液：① 6 ml ∶ 15 mg；② 6 ml ∶ 30 mg。

复方托吡卡胺滴眼液[保(乙)]

Compound Tropicamide Eye Drops

【适应证】用于散瞳和调节麻痹。

【注意事项】(1) 有眼压升高因素的前房角狭窄、浅前房者慎用，必要时测量眼压或用缩瞳药。(2) 高血压、动脉硬化、冠状动脉供血不足、糖尿病、甲状腺功能亢进者慎用。(3) 出现过敏症状或眼压升高应停用。(4) 本品滴眼有作用强、起效快、持续时间短的特点，但瞳孔散大后有 5 ～ 10 小时的畏光及近距离阅读困难的现象。(5) 滴眼后应压迫泪囊部 2 ～ 3 分钟，以防经鼻黏膜吸收过多引发全身不良反应。(6) 由于残余调节力的存在，不太适合于少年儿童睫状肌麻痹下验光。(7) 未成熟新生儿滴用可能发生心搏减缓、呼吸停止。对儿童的安全性尚未确立，宜慎用。

【禁忌证】(1) 未手术的闭角型青光眼患者禁用。(2) 婴幼儿有脑损伤、痉挛性麻痹及先天愚型综合征反应强烈患者禁用。

【不良反应】(1) 偶见眼局部刺激症状。(2) 亦可使开角型青光眼患者眼压暂时轻度升高，由于去氧肾上腺素本身具有降眼压的作用将不会造成视神经的损害。

【用法与用量】滴眼：①散瞳检查：本品滴入结膜囊内，一次 1 滴，间隔 5 分钟再滴第 2 次。本品滴眼后 5 ～ 10 分钟开始散瞳，15 ～ 20 分钟瞳孔散得最大。约维持 1.5 小时后开始缩瞳，5 ～ 10 小时瞳孔恢复至滴药前水平。②屈光检查：应用本品每 5 分钟滴眼 1 次，连续滴 4 次，20 分钟后可做屈光检查。考虑残余调节力的存在，故不太适用于 12 岁以下的少

年儿童睫状肌麻痹下验光。

【制剂与规格】复方托吡卡胺滴眼液：① 5 ml，内含托吡卡胺 25 mg 和盐酸去氧肾上腺素 25 mg；② 10 ml，内含托吡卡胺 50 mg 和盐酸去氧肾上腺素 50 mg。

去氧肾上腺素滴眼液

Phenylephrine Eye Drops

【适应证】散瞳，用于检查眼底及晶状体，鉴别闭角型或开角型青光眼（后者用此药后眼压不增高）。

【注意事项】(1) 本品根据需要可配成 2%～10%的溶液。(2) 儿童及老人应当避免使用 10%浓度的溶液。(3) 心血管疾病患者应当避免使用，或只能使用 2% 浓度的溶液。(4) 心动过速、甲状腺功能亢进、糖尿病患者慎用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏和青光眼患者禁用。(2) 服用单胺氧化酶抑制药，如异咪唑肼、硫酸苯乙肼、硫酸反苯环丙胺和三环抗抑郁药，如丙米嗪、阿米替林、普罗替林、多虑平等时禁用本品滴眼。(3) 孕妇禁用。(4) 婴幼儿禁用。

【不良反应】(1) 眼部：眼痛及针刺感、视物模糊、畏光。罕见不良反应为诱发闭角型青光眼急性发作。(2) 全身：心律失常、冠状动脉痉挛、高血压等。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 1～5 次。散瞳用时，常用浓度 5% 或 10%，每隔 5 分钟滴 1 次，连续 2 次，于 30 分钟内即呈现散瞳。

【制剂与规格】盐酸去氧肾上腺素滴眼液：① 25 ml : 0.1 g；② 5 ml : 0.25 g；③ 5 ml : 0.5 g。

（其他见 4.10）

13.5 青光眼及其用药

青光眼（glaucoma）是一类严重的致盲眼病。到目前为止，只有降低眼压才能控制青光眼的病情。对于大多数原发性开角型青光眼患者来说，首选的是应用药物治疗来降低眼压。对于原发性闭角型青光眼，首要的问题是解除前房角关闭，可以进行激光或手术周边虹膜切除术，使后房水经过虹膜切除孔进入前房，消除或减轻周边部虹膜向前膨隆，开放前房角。但在进行周边部虹膜切除术之前，需要应用药物治疗来降低眼压和防止前房角关闭。一些原发性闭角型青光眼患者由于治疗不及时或不合理，导致前房角粘连性关闭，单纯施行周边部虹膜切除术并不能降低眼压，需要施行眼外滤过术。虽然大多数患者在手术后能满意地控制眼压，但是仍然有相当一部分患者需要加用药物来控制眼压。总之，通过药物治疗来降低眼压是处理青光眼的主要措施。

多种不同作用机制的药物可以降低眼压。眼部滴用的 β 肾上腺素受体拮抗药或前列腺素类似物通常是首选的药物。在一些病例中，有必要联合应用这些药物，或者需要加用其他药物，如缩瞳药、交感神经兴奋药及碳酸酐酶抑制药等，以便控制眼压。

在一些高眼压或需要手术的情况，需要紧急地降低眼压，可以应用 20% 甘露醇静脉滴注，用量可以大至 500 ml。

13.5.1 β 肾上腺素受体拮抗药

眼部滴用 β 肾上腺素受体拮抗药可以有效地降低眼压。口服 β 肾上腺素受体拮抗药也可以降低眼压，但是这种给药方式有明显的不良反应，因此不再应用这种方式给药。

用于青光眼的 β 肾上腺素受体拮抗药有卡替洛尔、左布诺洛尔、美替洛尔、噻吗洛尔和倍他洛尔。除了倍他洛尔是选择性的 β_1 肾上腺素受体拮抗药外，其余几种都是非选择性 β_1 和 β_2 肾上腺素受体拮抗药，都有较好的降低眼压的作用，可以根据患者的情况选用。

眼部给药后可以全身吸收，因此含有 β 肾上腺素受体拮抗药的滴眼液禁用于心动过缓、房室传导阻滞或未控制的心力衰竭患者。滴用 β 肾上腺素受体拮抗药后眼部不良反应包括眼部针刺感、烧灼感、疼痛、眼痒、红斑、眼干及过敏反应（包括过敏性结膜炎和睑结膜炎）。偶有引起角膜病变的报道。

β 肾上腺素受体拮抗药，或者即使是心脏选择性的 β_1 肾上腺素受体拮抗药，也不能用于哮喘或有气道阻塞性病史的患

者，除非没有其他药物可供选择。在可能诱发支气管痉挛风险的情况下，应用β肾上腺素受体拮抗药应当格外谨慎。

β肾上腺受体拮抗药可能掩盖急性低血糖症状，因此糖尿病患者使用β肾上腺素受体拮抗药要特别注意，尤其是原发性低血糖患者、正在接受胰岛素治疗或口服降糖药物的患者。β肾上腺素受体拮抗药会掩盖甲状腺功能亢进的临床体征，如心动过速。

妊娠及哺乳期妇女慎用β肾上腺素受体拮抗药。

卡替洛尔滴眼液[保（乙）]

Carteolol Eye Drops

【适应证】用于青光眼、高眼压症。

【注意事项】(1) 对β肾上腺素受体拮抗药有禁忌及过敏者慎用。(2) 肝功能低下者慎用。(3) 自发性低血糖患者及接受胰岛素或降糖药治疗的患者慎用。(4) 儿童慎用。(5) 孕妇及哺乳期妇女慎用，在确有应用指征时，应权衡利弊后决定是否使用。(6) 对明显心脏病患者，应用本品应检测心率。(7) 本品不宜单独用于治疗闭角型青光眼。(8) 与其他滴眼液合用时宜隔10分钟以上。

【禁忌证】(1) 本品过敏者。(2) 支气管哮喘或有支气管哮喘史，严重慢性阻塞性肺部疾病。(3) 窦性心动过缓、二或三度房室传导阻滞、明显心力衰竭、心源性休克。

【不良反应】(1) 偶见局部不良反应，视物模糊、畏光、角膜着色，出现暂时性眼烧灼刺痛及流泪、结膜充血。全身不良反应：心率减慢、呼吸困难、无力、头痛、头晕。(2) 罕见不良反应为恶心。(3) 长期连续用于无晶状体眼或眼底病变者时，偶可发生黄斑部水肿，故需定期测定视力和检查眼底。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日2次。滴于结膜囊内，滴后用手指压迫内眦角泪囊部3～5分钟。效果不明显时，改用2%制剂，一次1滴，一日2次。

【制剂与规格】盐酸卡替洛尔滴眼液：① 5 ml : 50 mg，② 5 ml : 100 mg。

左布诺洛尔滴眼液[保（乙）]

Levobunolol Eye Drops

【适应证】(1) 用于原发性开角型青光眼。(2) 用于某些继发性青光眼，高眼压症，手术后未完全控制的闭角型青光眼以及其他药物及手术无效的青光眼，加用本品滴眼可进一步增强降眼压效果。

【注意事项】(1) 已知是全身β肾上腺素受体拮抗药禁忌的患者，包括异常心动过缓、一度以上房室传导阻滞患者慎用。(2) 先天性心力衰竭患者应得到适当控制后，才能使用本品。(3) 对有明显心脏疾病患者应用本品应监测脉搏。(4) 对其他β肾上腺素受体拮抗药过敏者慎用。(5) 已有肺功能低下的患者慎用。(6) 自发性低血糖患者及接受胰岛素或降糖药治疗的患者慎用。(7) 本品不宜单独用于治疗闭角型青光眼。(8) 与其他滴眼液联合使用时，应间隔10分钟以上。(9) 本品含氯化苯烷铵，戴软性角膜接触镜者不宜使用。(10) 使用中若出现脑供血不足症状时应立即停药。(11) 重症肌无力患者，用本品滴眼时需遵医嘱。(12) 定期复查眼压，根据眼压变化调整用药方案。

【禁忌证】(1) 支气管哮喘或有支气管哮喘史、严重慢性阻塞性肺部疾病患者禁用。(2) 窦性心动过缓、二或三度房室传导阻滞、明显的心力衰竭及心源性休克患者禁用。

【不良反应】(1) 1/3的患者出现暂时性眼烧灼及眼刺痛；5%的患者出现结膜炎；一些患者出现心率减慢及血压下降。(2) 其他少见不良反应，包括心律变化、呼吸困难、虹膜睫状体炎、头痛、头晕、一过性共济失调、嗜睡、瘙痒及荨麻疹。(3) 罕见不良反应，包括：①全身症状，如无力、胸痛；②心血管系统，如心动过缓、心律失常、低血压、晕厥、房室传导阻滞、脑血管意外、脑缺血、心力衰竭、心绞痛、心悸、心搏停止；③消化系统，如恶心、腹泻；④神经系统，如抑郁、精神错乱、加重重症肌无力的症状、感觉异常；⑤皮肤，过敏反应，如瘙痒及荨麻疹、脱发、Stevens-Johnson综合征；⑥呼吸系统，如支气管痉挛、呼吸衰竭、呼吸困

难、鼻腔充血；⑦内分泌系统，如掩盖糖尿病患者应用胰岛素或降糖药后的低血糖症状；⑧泌尿生殖器系统，如阳痿。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 1～2 次。滴于结膜囊内，滴后用手指压迫内眦角泪囊部 3～5 分钟。

【制剂与规格】盐酸左布诺洛尔滴眼液：① 5 ml : 25 mg；② 10 ml : 50 mg。

美替洛尔滴眼液

Metipranolol Eye Drops

【适应证】(1) 用于高眼压症、慢性开角型青光眼、无晶状体性青光眼。(2) 用于假性晶状体囊膜剥脱性青光眼、色素型青光眼、先天性和新生血管性青光眼。

【注意事项】(1) 不宜与单胺氧化酶抑制药合用。(2) 本品剂量的个体差异较大，宜从小到大试用，以选择适宜的剂量。长期用药时不可突然停药。(3) 充血性心力衰竭患者（继发于心动过速者除外），须等心力衰竭得到控制后始可用本品。(4) 不宜与抑制心脏的麻醉药（如乙醚）合用。

【禁忌证】(1) 窦性心动过缓、重度房室传导阻滞、心源性休克、低血压症患者禁用。(2) 有增加洋地黄毒性的作用，对已洋地黄化而心脏高度扩大、心率又较不平稳的患者禁用。(3) 哮喘及过敏性鼻炎患者禁用。

【不良反应】(1) 睑结膜炎，一过性眼烧灼、刺激感、心率下降，偶有报道降低血压。(2) 罕见不良反应，包括呼吸困难、虹膜睫状体炎、额痛、头痛、肝酶活性升高、嗳气、一过性共济失调、嗜睡、头晕、瘙痒及荨麻疹。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 2 次。从低浓度开始使用，如未能达到疗效或维持治疗，可改用较高浓度滴眼液。仅在 0.3% 浓度滴眼液治疗无效时，方可改用 0.6% 浓度滴眼液。

【制剂与规格】美替洛尔滴眼液：① 5 ml : 5 mg；② 5 ml : 15 mg；③ 5 ml : 30 mg。

噻吗洛尔 [基(基)，保(甲)]

Timolol

【适应证】(1) 用于原发性开角型青光眼。(2) 用于某些继发性青光眼，高眼压症，部分原发性闭角型青光眼以及其他药物及手术无效的青光眼，加用本品滴眼可进一步增强降眼压效果。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见左布诺洛尔。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 1～2 次，如眼压已控制，可改为一日 1 次。如原用其他药物，在改用本口治疗时，原药物不宜突然停用，应自滴用本品的第 2 天起逐渐停用。（其他见 4.7）

【制剂与规格】噻吗洛尔滴眼液：① 5 ml；② 25 mg。

倍他洛尔滴眼液 [保(乙)]

Betaxolol Eye Drops

【适应证】用于慢性开角型青光眼和高眼压症。

【注意事项】糖尿病、甲状腺功能亢进、肌无力、肺功能不全患者慎用。

【禁忌证】窦性心动过缓、一度以上房室传导阻滞、有明显心力衰竭患者禁用。

【不良反应】(1) 视物模糊、点状角膜炎、异物感、畏光、流泪、痒、干燥、红斑、发炎、分泌物增多、视力降低、过敏反应、水肿、角膜敏感性降低及瞳孔大小不一。(2) 心动过缓、房室传导阻滞及充血性心力衰竭。(3) 可能会有因呼吸困难、支气管痉挛、气管分泌物浓稠、气喘或呼吸衰竭而产生肺压迫感，失眠、眩晕、头晕、头痛、忧郁、嗜睡、荨麻疹、中毒性表皮坏死、脱毛、舌炎等。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 2 次。如本品尚不足以控制患者眼压时，可并用毛果芸香碱、肾上腺素或服用碳酸酐酶抑制药（如乙酰唑胺）等。

【制剂与规格】盐酸倍他洛尔滴眼液：5 ml : 12.5 mg。

（其他见 4.7）

13.5.2 前列腺素类似药

拉坦前列素和曲伏前列素是前列腺素类似药物，可以增加房水经脉络膜巩膜途径外流。比马前列素也是前列腺素类相关的药物。这些药物可以降低高眼压症或开角型青光眼患者的眼压，作用比 β 肾上腺

素受体拮抗药要强，而且用药次数少，应用方便。

拉坦前列素滴眼液[保(乙)]

Latanoprost Eye Drops

【适应证】用于治疗青光眼和高眼压症，以及各种眼压增高的情况。

【注意事项】(1) 使用含硫柳汞制剂5分钟之内者不得使用本品。(2) 治疗前，告知患者用药后虹膜颜色可能会加深，在用药过程中应当注意虹膜颜色的改变。(3) 在无晶状体眼、伴有晶状体后囊膜撕裂的人工晶状体眼或前房型人工晶状体眼、具有发生葡萄膜炎和黄斑囊样水肿危险因素的患者慎用。(4) 哮喘患者慎用。(5) 孕妇不宜使用；哺乳期妇女不宜使用，或停止哺乳。(6) 儿童不宜使用。

【禁忌证】角膜接触镜佩戴者禁用。

【不良反应】(1) 虹膜颜色加深、睑缘炎、眼部刺激症状和疼痛；眼睫毛变黑增粗增长；结膜充血、暂时点状角膜上皮糜烂、眼睑水肿和红斑；皮疹。(2) 罕见不良反应为呼吸障碍、哮喘加重、虹膜炎、葡萄膜炎、眼睑皮肤变黑。(3) 极罕见不良反应为胸痛、咽炎。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日1次。晚间使用效果较好。

【制剂与规格】拉坦前列素滴眼液：① 1 ml : 50 μg；② 2.5 ml : 125 μg。

曲伏前列素滴眼液[保(乙)]

Travoprost Eye Drops

【适应证】用于降低开角型青光眼或高眼压症患者的眼压。

【注意事项】(1) 患者虹膜棕色素可能逐步增加，这些改变可能在几个月或几年都不很明显。通常棕色素从受影响眼的瞳孔周围向外周呈向心性分布，但整个虹膜或部分虹膜颜色会变深。患者应根据情况定期进行检查。(2) 具有眼部炎症史的患者，(如葡萄膜炎症) 慎用。(3) 无晶状体患者，晶状体后囊膜破裂的人工晶状体患者或有黄斑水肿危险因素的患者慎用。(4) 佩戴角膜接触镜时禁止使用。使用本品前应将接触镜摘除。在滴入本品15分钟后再重新佩戴。(5) 本品的降眼压作用大约在用药2小时后开始出现，在12小时达到最大。本品可以和其他眼局部用药的降眼压药物一起使用。

【禁忌证】急性眼部感染的患者禁用。

【不良反应】(1) 35% ~ 50% 的患者眼充血。大约3% 的患者因结膜充血停止用药。(2) 5% ~ 10% 的眼部不良反应包括视力下降、眼部不适、异物感、疼痛、瘙痒。(3) 1% ~ 4% 的眼部不良反应包括视力异常、视物模糊、眼部不适、异物感、畏光、流泪、睑缘结痂、眼睑炎、结膜炎、结膜下出血、干眼、角膜炎、虹膜异色、前房炎性细胞、房水闪光和白内障。(4) 非眼部不良反应占1% ~ 5%，包括外伤、心绞痛、焦虑、关节炎、背痛、心动过缓、气管炎、胸痛、感冒综合征、抑郁、消化不良、胃肠功能紊乱、头痛、高胆固醇血症、高血压、低血压、感染、疼痛、前列腺功能紊乱、窦炎、尿失禁和尿道感染。

【用法与用量】滴眼：每晚1次，一次1滴。

【制剂与规格】曲伏前列素滴眼液：2.5 ml : 0.1 mg。

比马前列素（贝美前列素）滴眼液[保(乙)]

Bimatoprost Eye Drops

【适应证】用于降低开角型青光眼。或高眼压症患者的眼压。

【注意事项】(1) 使用含硫柳汞制剂5分钟之内者不得使用本品。(2) 治疗前告知患者用药后虹膜颜色可能会加深，在用药过程中应当注意虹膜颜色的改变。(3)在无晶状体眼、伴有晶状体后囊膜撕裂的人工晶状体眼或前房型人工晶状体眼、具有发生葡萄膜炎和黄斑囊样水肿危险因素的患者慎用。(4) 哮喘患者慎用。(5) 孕妇和哺乳期妇女不宜使用，或停止哺乳。(6) 儿童和18岁以下青少年不宜使用。(7) 每晚于患眼内滴入本品1滴。频繁使用可降低本品的降眼压作用。(8) 本品可与其他眼部滴用的降眼压药物联合使用。

【禁忌证】对本品中任何成分过敏者。

【不良反应】(1) 虹膜颜色加深、睑

缘炎、眼部刺激症状和疼痛；眼睫毛变黑增粗增长；结膜充血、暂时点状角膜上皮糜烂、眼睑水肿和红斑；皮疹。(2) 罕见不良反应为呼吸障碍、哮喘加重、虹膜炎、葡萄膜炎、眼睑皮肤变黑。(3) 极罕见不良反应为胸痛、咽炎。(4) 眼痒、过敏性结膜炎、白内障、结膜水肿、分泌物、畏光、浅层点状角膜炎，头痛，高血压。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 1 次，夜间使用。

【制剂与规格】比马前列素滴眼液：1 ml : 0.3 mg。

13.5.3 肾上腺素受体激动药

肾上腺素通过减少房水生成和增加房水经小梁网的外流来发挥药效。由于肾上腺素具有散瞳作用，因此在有发生原发性闭角型青光眼倾向的人中应用时必须谨慎，除非这些人已经做过周边虹膜切除术。肾上腺素的不良反应包括眼部剧烈刺痛、眼红。肾上腺素用于高血压和心脏病患者时应当格外小心。滴入药物后用手指压迫内眦角泪囊部 3 ~ 5 分钟。

地匹福林是肾上腺素的前体药，它比肾上腺素更快速地透过角膜，然后转化为活性成分而发挥药物作用。

溴莫尼定为选择性 α_2 肾上腺素受体兴奋药。在单用 β 肾上腺素受体拮抗药不能满意地降低眼压的开角型青光眼或高眼压症患者中，应用溴莫尼定降低眼压是合理的。当其他降眼压药物不能满意地控制眼压时，溴莫尼定可以作为辅助治疗。

溴莫尼定滴眼液 [保（乙）]

Brimonidine Eye Drops

【适应证】用于降低开角型青光眼和高眼压症患者的眼压。

【注意事项】(1) 用药后困倦会影响到熟练工作的完成，例如驾驶车辆。(2) 滴用本品至少 15 分钟后才可佩戴角膜接触镜。

【禁忌证】(1) 严重心血管疾病、脑或冠状动脉供血不足、肢端动脉痉挛综合征、直立性低血压、抑郁症、肝肾功能不全患者禁用。(2) 孕妇及哺乳期妇女禁用。(3) 使用单胺氧化酶抑制药治疗的患者禁用。

【不良反应】眼部反应包括结膜充血、灼烧、刺痛、眼痒、过敏、结膜滤泡增生、视觉障碍、睑缘炎、流泪、角膜糜烂、浅层点状角膜炎、眼痛、分泌物、眼干、眼部刺激、眼睑炎症、结膜炎、畏光。此外还有高血压、头痛、抑郁、口干、疲劳、困倦。较少见的不良反应有味觉障碍、心悸、头晕、晕厥、鼻炎、鼻干。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 2 次。对眼压在下午达高峰的患者或需要额外控制眼压者，下午可增加 1 滴。

【制剂与规格】溴莫尼定滴眼液：5 ml : 10 mg。

地匹福林滴眼液 [保（乙）]

Dipivefrine Eye Drops

【适应证】(1) 用于降低开角型青光眼和高眼压症患者的眼压。(2) 用于对闭角型青光眼虹膜切除后的残余性青光眼。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用，在确有应用指征时，应权衡利弊后决定是否使用。(2) 无晶状体青光眼、高血压、心功能不全、甲状腺功能亢进患者慎用。

【禁忌证】未经手术的闭角型青光眼、甲状腺功能亢进、高血压、冠状动脉供血不全、心律失常及糖尿病等患者禁用。

【不良反应】(1) 滴眼后可出现轻微眼部灼烧、刺痛感，结膜滤泡增生、结膜充血、视物模糊、额痛、结膜角膜色素沉着。(2) 偶有枕部疼痛、心律失常、心率增快、血压增高、脸色苍白、发抖和出汗等。(3) 有引起散大瞳孔和无晶状体黄斑病变的可能。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】地匹福林滴眼液：① 5 ml : 5 mg；② 8 ml : 8 mg。

13.5.4 碳酸酐酶抑制药

碳酸酐酶抑制药，如乙酰唑胺、布林佐胺可以通过减少房水生成来降低眼压。当全身使用碳酸酐酶抑制药时可以减少尿量。

乙酰唑胺可以通过口服和静脉注射给

药，可作为降眼压治疗的辅助用药。乙酰唑胺是磺胺类药，偶尔能引起血液病、皮疹及与磺胺类药物有关的不良反应。一般不推荐长期使用。

布林佐胺是眼部滴用的碳酸酐酶抑制药，应用于β肾上腺素受体拮抗药疗效差的患者或那些禁用β肾上腺素受体拮抗药的患者。它可以单独使用或作为眼部滴用β受体拮抗药的辅助用药。使用后很少全身吸收，因此很少会引起磺胺药的不良反应。但如果发生严重的不良反应，则需要停药。

乙酰唑胺[基(基)、保(甲)]

Acetazolamide

【适应证】用于治疗各种类型的青光眼。对青光眼急性发作时的短期控制是一种有效的降低眼压的辅助药物。

【注意事项】(1) 肺功能障碍（酸中毒危险）、糖尿病、肝功能不全及肾功能不全患者慎用。(2) 老年患者慎用。(3) 孕妇慎用。(4) 一般不推荐长期使用。如要长期使用，则需要监控血细胞数、血浆电解质浓度。

【禁忌证】(1) 对本品或磺胺药过敏者禁用。(2) 肝肾功能不全所致低钾血症、低钠血症、高氯性酸中毒者禁用；(3) 肝性脑病者禁用。(4) 肾上腺衰竭及肾上腺皮质功能减退（阿狄森病）者禁用。

【不良反应】恶心、呕吐、腹泻、味觉失调、食欲缺乏、感觉异常、面部潮红、头痛、眩晕、疲劳、易激动、抑郁、性欲降低、代谢性酸中毒和电解质紊乱、嗜睡、意识模糊、听力障碍、荨麻疹、皲裂、尿糖增加、血尿、肾结石、血液病（包括粒细胞缺乏症和血小板减少症）、皮疹（包括多形性红斑和中毒性表皮坏死松解症）、光过敏、肝功能损害、迟缓性瘫痪、惊厥、暂时性近视。

【用法与用量】口服：①开角型青光眼，成人首量250 mg，一日1～3次，维持量应根据患者对药物的反应决定，尽量使用较小的剂量使眼压得到控制；一般一次250 mg，一日2次。②继发性青光眼和手术前降眼压，一次250 mg，每4～8小时1次，一般每日2～3次。③急性病例，成人首次药量500 mg，以后用维持量，一次125～250 mg，一日2～3次。

【制剂与规格】乙酰唑胺片：250 mg。

乙酰唑胺胶囊：250 mg。

布林佐胺滴眼液[保(乙)]

Brinzolamide Eye Drops

【适应证】用于开角型青光眼和高眼压症。可以作为对β肾上腺素受体拮抗药无效或有使用禁忌证的患者单独的治疗药物，或者作为β肾上腺素受体拮抗药的协同治疗药物。

【注意事项】(1) 肝损伤、妊娠者应慎用。(2) 不推荐儿童使用。(3) 滴用后应当注意有无全身不良反应。

【禁忌证】(1) 对本品或磺胺类药物过敏者禁用。(2) 严重肾功能不全（肌酐清除率低于每分钟30 ml）和高氯性酸中毒者禁用。(3) 哺乳期妇女禁用。

【不良反应】滴药后可有局部刺激症状、味觉障碍、异物感和眼部充血，少见眼干、眼痛、眼分泌物增多、角膜炎、流泪、视疲劳、视力异常、角膜糜烂等。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日2次，必要时一日3次。

【制剂与规格】布林佐胺滴眼液：5 ml : 50 mg。

13.5.5 拟M胆碱药

滴用缩瞳剂后可使瞳孔缩小。对于闭角型青光眼来说，瞳孔缩小可以拉紧虹膜，使周边部虹膜从房角前壁拉开，从而使前房角开放而降低眼压。对于开角型青光眼来说，缩瞳剂通过收缩睫状肌而引起小梁网眼张开，促使房水外流管道开放，增加房水外流，从而降低眼压。

毛果芸香碱[基(基)、保(甲)]

Pilocarpine

【适应证】降低原发性闭角型青光眼、原发性开角型青光眼和一些继发性青光眼的患者的眼压。

【注意事项】(1) 瞳孔缩小常引起暗适应困难，应告知需在夜间开车或从事照明不好的危险职业的患者特别小心。(2) 根据病情变化改变用药及治疗方案。

(3) 为避免吸收过多引起全身不良反应，滴眼后需用手指压迫泪囊部 1 ~ 2 分钟。(4) 如意外口服，需给予催吐或洗胃；如过多吸收出现全身中毒反应，应使用阿托品类抗胆碱药进行对抗治疗。(5) 哮喘、角膜炎患者慎用。(6) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(7) 儿童慎用。因患儿体重轻，易用药过量引起全身中毒。

【禁忌证】任何不应缩瞳的患者，如虹膜睫状体炎和继发性青光眼等禁用。

【不良反应】(1) 缩瞳剂引起的睫状肌痉挛会导致头痛和偏头痛，在滴用缩瞳剂的最初 2 ~ 4 周较为严重。(2) 眼部不良反应包括眼部灼烧感、眼痒、刺痛、视物模糊、结膜充血、近视、晶状体变化、玻璃体积血、瞳孔阻滞。(3) 流涎、出汗、胃肠道反应和支气管痉挛等全身性不良反应罕见。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼。①慢性青光眼，0.5% ~ 2% 溶液，一次 1 滴，一日 1 ~ 4 次。②急性闭角型青光眼急性发作期，1% ~ 2% 溶液，一次 1 滴，每 5 ~ 10 分钟 1 次，3 ~ 6 次后每 1 ~ 3 小时 1 次，直至眼压下降（注意：对侧眼每 6 ~ 8 小时滴眼 1 次，以防对侧眼闭角型青光的发作）。③缩瞳。对抗散瞳作用，1% 溶液滴眼 1 滴。(2) 眼膏：点眼，每晚涂搽 1 次。

【制剂与规格】硝酸毛果芸香碱滴眼液：① 10 ml : 50 mg；② 10 ml : 100 mg；③ 10 ml : 200 mg。

硝酸毛果芸香碱眼膏：2 g : 40 mg。

13.5.6 高渗药

高渗药，如静脉注射的甘露醇、口服的甘油盐水，都是快速有效的短期降眼压药物，常用于降低急性闭角型青光眼和一些继发性青光眼的眼压。高渗药也用于内眼手术前减少玻璃体容积。静脉给药的高渗药的降眼压作用比口服高渗药强，起效快。

甘露醇 [基(基)，保(甲)]

Mannitol

【适应证】用于降低眼压，特别是急性眼压升高时，或准备内眼手术时。

【注意事项】(1) 严格掌握适应证，对于眼压不是太高者，或是年龄较大者尽量不用，对于肾功能损害或者有潜在疾病者，应避免或减量使用。(2) 过敏体质者尽量不用，如必须使用，可先给予地塞米松 10 mg 静脉注射，并严密观察。(3) 使用本品的时间不宜过长，剂量不宜过大。(4) 使用本品过程中应注意水、电解质平衡，定期复查肾功能。

【禁忌证】肾衰竭、心功能不全、酸血症、脱水及活动性颅内出血者禁用。

【不良反应】(1) 电解质紊乱。(2) 血尿。(3) 过敏。(4) 急性肾衰竭。(5) 尿潴留、肺水肿或充血性心力衰竭。(6) 低颅压综合征。

【用法与用量】静脉注射，20% 溶液，2 ~ 3 g/kg。滴注速度宜快（每分钟 3 ~ 10 ml）。

【制剂与规格】甘露醇注射液：20%，每瓶 250 ml。

甘油氯化钠注射液

Glycerol and Sodium Chloride Injection

【适应证】降低眼压，用于其他降眼压药无效时或内眼手术前准备。

【注意事项】(1) 甘油与甘露醇同样具有强烈的脱水作用，但两者药理性能不同。甘露醇是渗透性利尿药，注射后能增加血容量，对心脏负担较重，又不能被机体代谢吸收，只能由肾脏排出体外，形成大量排尿导致明显的电解质丢失，如长时期反复使用，极易造成脱水及电解质丢失。而本品可被机体全部代谢并氧化成营养物质，不出现大量排尿现象。(2) 甘露醇制品常有结晶现象，临床使用需保温。而本品则无此弊端。(3) 本品为甘露醇注射液的优良替代品，可避免甘露醇注射液引起的不良反应：①水和电解质紊乱；②心力衰竭，稀释性低钠血症及偶然的高钾血症；③不适当的过度利尿导致的血容量减少，加重少尿。

【禁忌证】心力衰竭、高钠血症、严重脱水、无尿者、对其成分过敏者。

【不良反应】可能出现血红蛋白尿或血尿，发生率与滴注速度过快有关，故应

严格控制滴注速度（每分钟 2 ~ 3 ml）。一旦发生血尿或血红蛋白尿，应及时停药，2 日内即可消失。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：一次 500 ml，一日 1 ~ 2 次，滴注速度应缓慢，每分钟不超过 3 ml。(2) 口服：一次 100 ~ 200 ml，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】甘油氯化钠注射液：① 250 ml：(甘油 25 g，氯化钠 2.25 g)；② 500 ml：(甘油 50 g，氯化钠 4.5 g)。

甘油氯化钠溶液：500 ml：甘油 250 g，氯化钠 4.5 g。

13.6 眼用局部麻醉药

对于眼科来说，局部麻醉是最常用的麻醉方法。眼科的局部麻醉包括表面麻醉、浸润麻醉和传导阻滞麻醉等。

丁卡因和奥布卡因是广泛使用的局部麻醉药。丙美卡因刺激小，因此多用于儿童。奥布卡因或利多卡因和荧光素的混合制剂可以用于眼压测量。丁卡因可以产生深度麻醉，适合用于眼科小手术前麻醉，例如角膜缝线的拆除。利多卡因单独或与肾上腺素合用，可以注入眼睑后施行小手术，进行球后或球周注射后可以施行眼球的手术。

局部麻醉药不能单纯作为镇痛药来解除眼部症状。也不能交与患者自行滴用。

丁卡因滴眼液[保(甲/乙)]

Tetracaine Eye Drops

【适应证】用于眼科表面麻醉，如测量眼压、眼部手术、角膜异物剔除等麻醉。

【注意事项】【禁忌证】见 17.3。

【不良反应】(1) 滴眼后有短暂烧灼感。(2) 对角膜上皮有轻度损伤，影响创伤角膜上皮再生。(3) 有发生过敏的可能。(4) 大剂量使用可致心脏传导系统和中枢神经系统抑制。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴。

【制剂与规格】盐酸丁卡因滴眼液：① 5 ml：25 mg；② 5 ml：50 mg。

盐酸利多卡因注射液[保(甲)] 用于眼用局部麻醉。(其他见 17.3)

奥布卡因

Oxybuprocaine

【适应证】用于眼科表面麻醉。

【注意事项】本品对瞳孔无影响，但反复多次使用可导致角膜炎和角膜严重损害。

【禁忌证】对本品的成分或对酯类（除可卡因外）局部麻醉药有过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 可有休克、过敏样症状。(2) 频繁使用有可能引起角膜损伤。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，可以根据年龄、体质适当增减。

【制剂与规格】盐酸奥布卡因滴眼液：① 1 ml：4 mg；② 5 ml：20 mg；③ 20 ml：80 mg。

丙美卡因滴眼液

Proparacaine Eye Drops

【适应证】用于各种眼科手术及眼科检查的表面麻醉。

【注意事项】(1) 甲状腺功能亢进或心脏病患者慎用。(2) 表面麻醉药不宜长期使用，以免引起角膜损伤、视力减退或伤口愈合延迟。(3) 使用本品时防止异物进入眼内，并禁止揉搓眼睛。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】长期频繁使用可能引起角膜损伤、视力减退或伤口愈合延迟。

【用法与用量】滴眼：(1) 短时间麻醉，操作前一般为 1 ~ 2 滴。必要时可追加 1 滴。(2) 取异物或缝线拆除等小手术，一次 1 ~ 2 滴，间隔 5 ~ 10 分钟，使用 1 ~ 3 次。(3) 白内障摘除等长时间手术，一次 1 ~ 2 滴，间隔 5 ~ 10 分钟，使用 3 ~ 5 次。

【制剂与规格】盐酸丙美卡因滴眼液：15 ml：75 mg。

13.7 眼科其他用药

13.7.1 人工泪液、眼润滑剂和收敛药

由眼泪分泌减少或异常所引起慢性眼部不适（例如 Sjögren 综合征），通常采用泪液补偿疗法，即滴用人工泪液有较好的反应。眼部不适的严重程度和患者的喜好，常常影响患者对人工泪液的选择。

羟丙甲基纤维素是治疗泪液不足的传统治疗方法。需要频繁滴药（例如一小时1次），才能使症状获得充分缓解。卡波姆具有黏附于眼表的特性，有助于减少用药频次至一日4次。聚乙烯醇可以增加泪膜持续时间，当眼表黏蛋白减少时可以起到积极的作用。聚维酮滴眼液也可以用于泪液缺乏症的治疗。0.9%氯化钠滴眼液有时对泪液缺乏症有用，滴用后也可以使角膜接触镜佩戴者感到舒适。0.9%氯化钠溶液和其他冲洗液常规地应用于内眼手术。

含有石蜡的眼膏可以润滑眼表，尤其适用于复发性角膜上皮糜烂的患者，但可能引起短暂的视觉障碍，因此最好在睡前使用。在佩戴接触镜时不应当使用眼膏。

硫酸锌是一种传统的收敛药。

人工泪液[保(乙)]

Artificial Tears

【适应证】治疗包括角结膜炎干燥症及泪膜不稳定或角膜缺乏润湿所产生的干眼症。

【注意事项】(1)放在儿童不易取得处。除非利益远大于对胎儿的潜在危险，孕妇及哺乳期妇女勿应用本品（妊娠类型C）。(2)应用本品时，应先取下角膜接触镜，用后30分钟，才可佩戴。(3)应用后出现视物模糊时，在视力恢复前最好避免开车或操作机器。

【禁忌证】已知对凝胶的任何成分过敏者。

【不良反应】滴用后偶有短暂的烧灼感，胶粘眼睑及（或）视物模糊，极少发生过敏反应。

【用法与用量】成人或儿童，一日3～4次，一次1滴，或视需要，根据病情严重程度而度，保持药管垂直，滴1滴于结膜囊内。

【制剂与规格】人工泪液：① 5 ml；② 15 ml。

羟丙甲基纤维素滴眼液

Hypromellose Eye Drops

【适应证】用于舒缓由于长期阅读、使用计算机或置身于空调环境中而导致的眼睛过度使用、疲倦和干涩。

【注意事项】(1) 使用后如眼部持续刺激，则停止使用。(2) 本产品含有氯化苄烷胺，佩戴软性接触镜时不宜使用。

【禁忌证】对羟丙甲纤维素及其他辅料如苯扎氯铵等过敏者禁用。

【不良反应】在极少数人中可能会引起眼部不适，如眼睛疼痛、视物模糊、眼球持续发红或出现刺激。如使用后眼部的上述症状持续超过3日，则应停止使用该药，必要时去医院检查。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日3次，或根据病情需要滴用。

【制剂与规格】羟丙基甲基纤维素滴眼液：① 9 ml : 27 mg；② 18 ml : 54 mg。

羧甲基纤维素钠滴眼液

Carboxymethylcellulose Sodium Eye Drops

【适应证】(1) 用于缓解眼部干燥，或因暴露于阳光、风沙所引起的眼部烧灼、刺痛等不适感。(2) 用于保护眼睛，避免受到不良环境的进一步刺激。

【注意事项】(1) 为防止污染，勿将瓶嘴触及任何物体表面。不可重复使用，用后即弃。(2) 瓶嘴不得接触眼睛。(3) 如果应用时感觉眼痛、视力改变、眼睛持续充血或刺激感、症状加重或症状持续72小时以上，则应停止用药并就医。(4) 孕妇、哺乳期妇女、老年人和儿童应在医师指导下使用。(5) 包装完好的滴眼液方可使用。(6) 过敏体质者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】尚不明确。

【用法与用量】滴眼：一次1～2滴，或根据病情需要滴用。

【制剂与规格】羧甲基纤维素钠滴眼液：① 0.4 ml : 2 mg；② 0.4 ml : 4 mg。

卡波姆滴眼液

Carbomer Eye Drops

【适应证】用于干眼症泪液缺乏的替代治疗。

【注意事项】(1) 驾车或操纵机器时慎用。(2) 佩戴角膜接触镜时不宜使用。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者禁用。

【不良反应】用药后可能引起短暂的视物模糊。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日3～5次或更多，于白天和睡觉前使用。

【制剂与规格】卡波姆滴眼液：10 ml：20 mg。

玻璃酸钠（透明质酸钠）滴眼液[保（乙）]

Sodium Hyaluronate Eye Drops

【适应证】(1) 用于眼睛疲劳、眼干燥症、眼干燥综合征、Stevens-Johnson综合征等疾病。(2) 用于手术后药物性、外伤、光线对眼造成的刺激及戴角膜接触镜等引起的外因性疾病。

【注意事项】(1) 不要在佩戴角膜接触镜时使用。(2) 用后立即密封，2～8℃保存。

【禁忌证】青光眼或眼部有剧痛感者禁用。

【不良反应】可能引起短暂的视物模糊、刺激感、眼痒、结膜充血、睑皮肤炎等。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日5～6次，或根据症状适当增减。

【制剂与规格】玻璃酸钠滴眼液：① 0.4 ml：1.2 mg；② 5 ml：5 mg。

聚乙烯醇滴眼液

Polyvinyl Alcohol Eye Drops

【适应证】用于预防或治疗眼部干涩、异物感等刺激症状，或改善眼干燥症状。

【注意事项】(1) 使用本品后如有眼痛、视物模糊、持续充血及刺激感加重，应当停用本品，及时就医。(2) 不要在佩戴角膜接触镜时使用。(3) 过敏体质者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】用药后偶有眼部刺激症状和过敏反应。

【用法与用量】滴眼：一次1滴，一日5～6次，或根据症状适当增减。

【制剂与规格】聚乙烯醇滴眼液：① 0.8ml：11.2 mg（以聚乙烯醇计）；② 10 ml：140 mg（以聚乙烯醇计）。

重组牛碱性成纤维细胞生长因子[保（乙）]

Recombinant Bovine Basic Fibroblast Growth Factor（rb-bFGF）

【适应证】(1) 用于角膜上皮缺损和点状角膜病变，轻、中度干眼症，大疱性角膜炎，角膜擦伤，轻、中度化学烧伤，角膜手术及术后愈合不良。(2) 用于地图状（或营养性）单疱性角膜溃疡。

【注意事项】(1) 本品为蛋白类药物，应避免高温或冰冻环境，2～8℃冷藏。(2) 对感染性或急性炎症期角膜病者，须同时局部或全身使用抗生素或抗炎药。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】个别患者用药时可能出现刺痛感。

【用法与用量】(1) 滴眼液：滴眼，一次1滴，一日4～6次。(2) 凝胶剂：涂入结膜囊内，一日2次，早、晚各1次。

【制剂与规格】重组牛碱性成纤维细胞生长因子滴眼液：5 ml：12 000 U。

重组牛碱性成纤维细胞生长因子凝胶剂：5 g：21 000 U。

重组人碱性成纤维细胞生长因子[保（乙）]

Recombinant Human Basic Fibroblast Growth Factor

【适应证】促进创面愈合，可用于慢性创面、新鲜创面、烧伤创面。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】未见明显不良反应。

【用法与用量】将西林瓶中的重组人碱性成纤维细胞生长因子（rh-bFGF）干粉用注射用水或氯化钠注射液溶解后直接涂抹于或用喷雾器喷于清创后的伤患处，或在伤患处覆以适当大小的消毒纱布，将药液均匀滴加于纱布，适当包扎即可，rh-bFGF 的最适用量约为 90 U/cm^2 创伤面积。

【制剂与规格】外用重组人碱性成纤维细胞生长因子：4 000U。

小牛血去蛋白提取物[保(乙)]

Deproteinized Hemodrivative of Calf Blood

【适应证】用于各种病因引起的角膜溃疡、角膜损伤，酸或碱引起的角膜灼伤、大疱性角膜病变、神经麻痹性角膜炎、角膜和结膜变性。

【注意事项】(1) 为保证本品生物活性及治疗效果，应避免将本品置于高温环境。(2) 用药后请及时密封，使用时，瓶口不要触及眼部及手部。开启一周后不可再用。(3) 本品使用后会出现短暂视物模糊，因此用药后至少 20 分钟内，不可驾驶或操作机械。(4) 用药治疗期间，切勿戴隐形眼镜。(5) 孕妇及哺乳期妇女慎用，以防对胎儿或婴儿的潜在不良反应；儿童用药尚不明确；老年用药请遵医嘱。

【禁忌证】对小牛血去蛋白提取物眼凝胶所含成分或同类药品过敏者禁用。

【不良反应】使用本品后，可能出现局部刺疼或灼热感。同其他眼凝胶一样，本品使用后会出现短暂视物模糊。若出现皮肤过敏或认为与本品有关的其他不良反应，请及时就诊。

【用法与用量】滴于眼部患处，一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次，或遵医嘱。

【制剂与规格】小牛血去蛋白提取物眼凝胶：5 g : 1 g。

氯化钠滴眼液

Sodium Chloride Eye Drops

【适应证】用于暂时性缓解眼部干涩症状。

【注意事项】(1) 使用本品后如有眼部充血、红肿、眼痒，应及时就医。(2) 不能作为角膜接触镜冲洗液使用。(3) 使用 2 周后症状未缓解，应停药就医。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】尚无不良反应的报道。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 5 ~ 6 次。

【制剂与规格】氯化钠滴眼液：10 ml : 55 mg。

(其他见 11.3.1)

复方硫酸锌滴眼液

Compound Zinc Sulfate Eye Drops

【适应证】用于治疗结膜炎、沙眼等眼部感染。

【注意事项】偶有轻微痒感，短时间内可消失。

【禁忌证】葡萄糖 -6 磷酸脱氢酶缺乏(有溶血性贫血倾向) 者禁用。

【不良反应】用药后偶有轻微痒感、皮疹和发热。

【用法与用量】滴眼：一次 1 滴，一日 3 ~ 4 次。或遵医嘱。

【制剂与规格】复方硫酸锌滴眼液：1 ml，内含盐酸小檗碱 1 mg、硫酸锌 3 mg、硼酸 20 mg，塑料瓶装，每瓶 5 ml、8 ml、10 ml。

13.7.2 眼部诊断药

荧光素钠可用于眼表染色，检测眼表损伤和异物，或在 Goldmann 压平眼压计测量眼压时进行眼表染色。荧光素钠可用于静脉注射，用于诊断性眼底和虹膜血管的荧光素血管造影。注射用吲哚菁绿在眼科中用于脉络膜血管造影，确定脉络膜疾患的位置。

荧光素钠[保(乙)]

Fluorescein Sodium

【适应证】用于诊断性眼底和虹膜血管的荧光素血管造影检查。

【注意事项】(1) 有过敏或支气管哮喘者使用静脉注射荧光素钠应特别注意，使用时应备有急救物品，以备注射荧光素钠后发生反应时用。(2) 注射荧光素钠前需做过敏试验。(3) 孕妇，特别是孕期头 3 个月的孕妇，应避免进行荧光素血管造影。哺乳期妇女慎用。(4) 静脉注射荧光素钠后皮肤会暂时发黄，可在 6 ~ 12 小时消退。尿液也呈黄色，可在 24 ~ 36 小时后恢复正常。(5) 静脉注射荧光素钠时应避免药液外渗。如有外渗可发生皮肤坏死脱落、浅层静脉炎、皮下肉芽肿、肘前区域的中毒性神经炎，并可引起长达数小时的手臂剧烈疼痛。如有药液外渗，应及时停止注射，采取措施治疗损伤组织，解

除疼痛。(6) 不要在注射器内与其他溶液或药物混合或稀释。

【禁忌证】对本品任何成分过敏者禁用。

【不良反应】静脉注射后可发生恶心、头痛、胃肠道不适、晕厥、呕吐、低血压以及过敏反应。已有使用本品后心搏停止、基底动脉缺血、严重休克、抽搐、注射部位发生血栓性静脉炎和注射侧手臂的钝痛、荨麻疹、瘙痒、支气管痉挛和过敏反应的报告。注射本品后可发生强烈的味觉改变。

【用法与用量】(1) 滴眼：①眼表染色，滴眼液（1% ~ 2%）滴入结膜囊内，一次 1 滴；②测量眼压时眼表染色，滴眼液(0.25% ~ 0.5%)，滴入结膜囊内。(2) 静脉注射：血管造影，5% 荧光素钠注射液一次 10 ml，或 10% 荧光素钠注射液一次 5 ml，缓慢静脉注射。

【制剂与规格】荧光素钠滴眼液：2 ml : 0.4 g。

荧光素钠注射液：① 5 ml : 0.5 g；② 3 ml : 0.3 g。

吲哚菁绿[保(乙)]

Indocyanine Green

【适应证】(1) 用于诊断各种肝脏疾病，了解肝脏的损害程度及其储备功能，用于诊断肝硬化、肝纤维化、韧性肝炎、职业和药物中毒性肝病。(2) 用于脉络膜血管造影，确定脉络膜疾患的位置。

【注意事项】(1) 有过敏性体质者慎用。用药前应预先备置抗休克急救药和器具。(2) 用灭菌注射用水溶解吲哚菁绿，并使其完全溶解。(3) 临用前调配注射液。如必须保存，应尽量选择阴凉处避光保存，并不得超过 4 小时。(4) 病人早晨空腹、仰卧位、安静状态下进行该项试验检查。(5) 胆囊造影剂、利胆剂、利福平、抗痛风药可造成本试验误差。(6) 尚无孕妇用药经验。哺乳期妇女需要使用时应停止哺乳。

【禁忌证】对本品和碘有过敏史者禁用。

【不良反应】(1) 可能引起休克、过敏样症状。(2) 本品不完全溶解时，可能发生恶心、发热、休克等反应。(3) 其他不良反应有恶心、呕吐、打嗝、荨麻疹、发热等。

【用法与用量】脉络膜血管造影时，25 mg 吲哚菁绿用灭菌注射用水 2 ml 溶解，迅速地肘静脉注射。

【制剂与规格】注射用吲哚菁绿：25 mg。

13.7.3 眼科围手术期用药

眼科围手术期用药包括用于准备眼科手术的药物、手术时注入前房的药物、手术后使用的药物。

多种抗菌滴眼液可用于眼科围手术期的无菌化治疗。非甾体抗炎药物滴眼液，如双氯酚酸钠、氟比洛芬、普拉洛芬、酮咯酸氨丁三醇已用于预防和治疗眼部手术和激光治疗相关的炎症、疼痛和其他症状。双氯酚酸钠、氟比洛芬也可用于预防眼科手术时瞳孔缩小。内眼使用的玻璃酸钠在眼部手术期间使用。卡巴胆碱能迅速缩小瞳孔，持续约 20 分钟。如果需要延长缩瞳时间，可以再次用药。平衡盐溶液在内眼手术时常规使用。

卡巴胆碱滴眼液

Carbachol Eye Drops

【适应证】用于人工晶状体植入、白内障摘除、角膜移植术等需要缩小瞳孔的手术。

【注意事项】本品不能用于口服、肌内注射和静脉注射。

【禁忌证】心血管疾患病（包括心律不齐、心动过缓、低血压)、迷走神经兴奋、癫痫、甲状腺功能亢进、帕金森病、支气管哮喘、消化性溃疡和尿路梗阻患者禁用。

【不良反应】(1) 常见视物模糊、眼痛、眼刺激或烧灼感。(2) 偶见头痛、眼部充血、眼睑抽搐。

【用法与用量】前房内注射：一次 0.2～0.5 ml。

【制剂与规格】卡巴胆碱注射剂：1 ml : 0.1 mg。

玻璃酸钠（透明质酸钠）[保（乙）]

Sodium Hyaluronate

【适应证】眼科手术辅助用品，主要用于白内障摘除、人工晶状体植入术、青光眼手术及角膜移植术等。

【注意事项】(1) 本品使用前必须先和室温平衡。(2) 避免向眼内注射过多的玻璃酸钠。(3) 手术结束时，可采用注洗法或抽吸法清除残留于眼内的玻璃酸钠。(4) 本品必须一次性使用。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】可出现一过性眼压升高。

【用法与用量】前房内注射：根据手术方式选择用量，一次约 0.2 ml。

【制剂与规格】玻璃酸钠注射液：① 0.5ml : 5 mg；② 1 ml : 17 mg。

13.7.4 眼用抑制新生血管药

眼部新生血管，特别是脉络膜新生血管膜是一种重要的眼部病变，可以导致不可逆的视力丧失。对于脉络膜新生血管膜可以采用激光视网膜光凝治疗，但对于黄斑中心凹下的脉络膜新生血管膜不能采用这种治疗，因为对黄斑中心凹的激光治疗将会破坏中心视力。采用维替泊芬进行光动力疗法治疗黄斑中心凹下新生血管膜取得了较好的效果。玻璃体腔内注射糖皮质激素和抑制新生血管的药物也取得了较好的效果，但在我国尚未批准上市。

维替泊芬可以用于年龄相关性黄斑变性伴有典型型黄斑中心凹下脉络膜新生血管膜，或病理性近视的黄斑中心凹下新生血管膜的光动力治疗。静脉输注维替泊芬后，通过非热性的红色激光局部照射，激活维替泊芬，产生细胞毒性诱导剂，破坏新生血管膜。只有有经验的专家才可以使用这种疗法。

维替泊芬

Verteporfin

【适应证】用于继发与年龄相关性黄斑变性、病理性近视或可疑眼组织胞浆菌病，以典型性为主型中心凹下脉络膜新生血管形成的患者。对于隐匿性中心凹下脉络膜新生血管为主的患者，尚无充分证据支持维替泊芬治疗。

【注意事项】(1) 对严重肝功能损害、胆道阻塞者避免使用。(2) 避免在妊娠期使用。(3) 配制好的溶液应当无沉淀和变色，避光保存，且在 4 小时内使用。(4) 避免选用手背小静脉，注射时避免药液外渗。一旦在输注过程中出现药液外渗，外渗的局部必须完全避光并局部冷敷，直至局部肿胀和变色完全消失，否则会出现严重的局部灼伤。(5) 输注后 5 日内，应适当采取防护措施，避免将皮肤和眼睛直接暴露于阳光直射或强的室内光源，以免发生光敏反应。

【禁忌证】卟啉症患者及已知对本品制剂中任何成分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 视力障碍（包括视物模糊、闪光、视野缺损）、恶心、背痛、无力、瘙痒、高胆固醇血症、发热等。(2) 罕见流泪、视网膜下或玻璃体积血、过敏反应（包括胸痛、晕厥、出汗、血压和心率改变）。(3) 注射部位的反应包括疼痛、水肿、发炎、出血、变色等。

【用法与用量】静脉滴注：临用前，将本品 15 mg 用灭菌注射用水 7 ml 溶解，制成浓度为 2 mg/ml 的溶液；然后按体表面积 6 mg/m^2 的剂量，取上述溶液用 5% 葡萄糖注射液适量稀释制成 30 ml 的溶液，以每分钟 3 ml 的速度静脉滴注。在药液滴注开始后 15 分钟，用波长（689 ± 3）nm、剂量 50 J/cm^2 的激光照射病灶局部，照射时间 83 秒。

【制剂与规格】注射用维替泊芬：15 mg。

13.7.5 微血管保护药

胰激肽原酶 [保（乙）]

Pancreatic Kininogenase

【适应证】用于微循环障碍性疾病，如糖尿病肾病、周围神经病、视网膜病变、眼底疾病及缺血性脑血管病，也可用于高血压病的辅助治疗。

【注意事项】(1) 本品用药前请详细询问过敏史。(2) 本品注射剂型仅供肌内注射给药。(3) 本品口服剂型为肠溶衣片，应整片吞服以防药物在胃中被破坏。

(4) 过敏性体质患者注射给药后请观察15～20分钟。(5) 注射处须备有肾上腺素水针、氧气和可以静脉注射的皮质类固醇等应急抢救药品。(6) 近期脑血管意外或有其他出血倾向者慎用。

【禁忌证】对本品过敏、脑出血及其他出血性疾病的急性期患者禁用。

【不良反应】偶见皮疹、瘙痒等过敏现象及胃部不适、倦怠等，停药后可消失。因注射给药偶会引起休克，使用时应充分观察。发现异常立即终止给药并进行适当处置。

【用法与用量】(1) 口服：一次120～240 U，一日3次。空腹服用。(2) 肌内注射：肌内注射，一日1次或隔日1次，每次10～40 U。可根据年龄、症状适当增减。(3) 结膜下注射：一次5 U。临用前以灭菌注射用水或氯化钠注射液1.5 ml溶解。

【制剂与规格】胰激肽原酶肠溶片：①60 U；②120 U；③240 U。

注射用胰激肽原酶：①10 U；②40 U。

羟苯磺酸[保(乙)]

Dobesilate

【适应证】用于糖尿病引起的视网膜病变和肾小球硬化症；微循环障碍引起的各种静脉曲张、血栓性静脉炎、瘙痒性皮炎、溃疡等。

【注意事项】(1) 使用本品需结合降糖药进行治疗，第一次使用本品前应咨询医师。(2) 治疗期间应定期到医院检查。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。妊娠最初3个月的孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】偶见胃部不适、恶心、胃灼热、食欲缺乏等症状，此时，应酌情减量，必要时暂停给药。

【用法与用量】进餐时吞服，在起始治疗阶段，一次0.25 g，一日3次；4～6周后，调整为一次0.25 g，一日2次。

【制剂与规格】羟苯磺酸钙胶囊：0.25 g。

第14章 耳、鼻、咽喉科疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 外耳道炎
- 中耳炎
- 耵聍栓塞
- 鼻炎
- 鼻窦炎
- 急性扁桃体炎
- 慢性咽炎
- 急性喉炎

14.1 耳疾病及其用药

14.1.1 外耳道炎的药物治疗

外耳道炎（otitis externa）是外耳道皮肤或皮下组织广泛的急、慢性炎症。根据病程可分为急性弥漫性外耳道炎和慢性外耳道炎。治疗急性外耳道炎应保持外耳道局部清洁、干燥和引流通畅；局部选用抗生素滴耳剂治疗；外耳道红肿时，局部滴用2%的酚甘油；严重的外耳道炎需全身应用广谱抗生素。慢性外耳道炎应保持局部清洁，并用使局部干燥的药物（3%硼酸乙醇等）。

14.1.2 中耳炎的药物治疗

分泌性中耳炎（secretory otitis media）是以中耳积液及听力下降为主要特征的中耳非化脓性炎性疾病。本病可分为急性和慢性两种。咽鼓管功能障碍是本病的重要原因之一。儿童需了解腺样体是否增生，成人要了解鼻咽部病变（注意排除鼻咽癌）。非手术治疗包括：①抗生素。急性分泌性中耳炎可选用青霉素类、大环内酯类、头孢菌素类等广谱抗生素口服或静脉滴注；②保持鼻腔及咽鼓管通畅。减充血剂如1%麻黄碱，盐酸羟甲唑啉滴（喷）鼻腔；③咽鼓管吹张。手术治疗包括：鼓膜穿刺术、鼓膜切开术、鼓膜切开加置管术、腺样体刮除术（3岁以上的儿童）、鼻息肉摘除术、下鼻甲部分切除术、鼻咽肿瘤切除术、鼻中隔矫正术等。

急性化脓性中耳炎（acute suppurative otitis media）是细菌感染引起的中耳黏膜的化脓性炎症。治疗：及早应用足量抗生素控制感染，可首选青霉素类、头孢菌素类，也可用大环内酯类等抗生素口服或静脉滴注；鼻减充血剂如盐酸羟甲唑啉、1%麻黄碱等滴鼻。局部治疗，鼓膜穿孔前可应用2%酚甘油滴耳；鼓膜穿孔后可先用3%过氧化氢溶液彻底清洗外耳道脓液，再以无耳毒性的抗生素滴耳剂滴耳。流脓已停止而鼓膜穿孔长期不愈合者，可做鼓膜修补术。

慢性化脓性中耳炎（chronic suppurative otitis media）是中耳黏膜、骨膜或

深达骨质的慢性化脓性炎症。按病理变化和临床表现可分为单纯型、骨疡型和胆脂瘤型3种。治疗：单纯型以局部用药为主，抗生素滴耳剂，用药前用3%过氧化氢溶液彻底清洗外耳道及鼓室的脓液，并用棉签拭干，然后方可滴药；静止期可行鼓膜修补术或鼓室成形术。骨疡型引流通畅者，可先予局部用药，定期复查。引流不畅及局部用药无效者，应手术治疗。胆脂瘤型应及早施行手术。

14.1.3 耵聍栓塞的药物治疗

在外耳道内耵聍（cerumen）聚积过多，形成较硬的团块，阻塞于外耳道内，称耵聍栓塞(impacted cerumen)。治疗：软化耵聍药物（碳酸氢钠滴耳剂等）滴耳，待耵聍软化后用温水将耵聍冲出，或用吸引器慢慢将耵聍吸出。

14.1.4 消毒防腐药滴耳剂

硼酸滴耳液

Boracic Acid Otic Drops

【适应证】用于急性中耳炎、慢性中耳炎、外耳道炎。

【注意事项】使用温度应接近体温，切忌接触眼睛。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】滴耳时可有短时间刺痛感。

【用法与用量】(1) 滴耳：成人一次1～2滴，儿童酌减，一日3次。(2) 清洗外耳道：用无菌棉签蘸取本品适量擦拭外耳道，一日3次。

【制剂与规格】硼酸滴耳液：10 ml：0.4 g。

酚甘油滴耳液

Phenol and Glycerin Otic Drops

【适应证】用于鼓膜未穿孔的急性中耳炎、外耳道炎。

【注意事项】本品对皮肤及黏膜有腐蚀性，浓度不宜超过2%。

【禁忌证】(1) 对本品所含成分过敏者禁用。(2) 鼓膜穿孔且流脓患者禁用。(3) 6个月以下婴儿禁用。

【用法与用量】滴耳：成人一次2～3滴，一日3次。儿童滴数酌减。

【制剂与规格】酚甘油滴耳液：① 10 ml：0.1 g；② 10 ml：0.2 g。

过氧化氢溶液[保(乙)]

Hydrogen Peroxide Solution

【适应证】用于急性化脓性中耳炎、慢性化脓性中耳炎及外耳道炎。

【注意事项】(1) 避免皮肤及黏膜接触高浓度溶液。(2) 本品遇氧化物或还原物即迅速分解并发生泡沫，遇光易变质。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】高浓度对皮肤和黏膜产生刺激性灼伤，形成一疼痛“白痂”。

【用法与用量】滴耳：成人一次5～10滴，儿童酌减，一日3次。滴药后数分钟用棉签擦净外耳道分泌物。

【制剂与规格】过氧化氢溶液（3%）：① 100 ml：3 g；② 500 ml：15 g。

14.1.5 抗菌药滴耳剂

氧氟沙星滴耳液[基(基)，保(甲)]

Ofloxacin Ear Drops

【适应证】用于敏感菌引起的中耳炎、外耳道炎、鼓膜炎。

【注意事项】(1) 本品一般用于中耳炎局限在中耳黏膜部位的局部治疗。若炎症已累及鼓室周围时，除局部治疗外，可同时加用口服抗生素。(2) 孕妇慎用。一般不用于婴幼儿。(3) 出现过敏症状时应立即停药。(4) 本品疗程不宜超过4周。(5) 使用本品时若药温过低，可能会引起眩晕。因此，使用温度应接近体温。

【禁忌证】(1) 对本品所含成分过敏者禁用。(2) 对喹诺酮类药过敏的患者禁用。

【不良反应】偶有中耳痛及瘙痒感。

【用法与用量】滴耳：成人一次6～10滴，儿童酌减，一日2～3次。滴耳后进行约10分钟耳浴。根据症状适当增减滴耳次数。

【制剂与规格】氧氟沙星滴耳液：5 ml：15 mg。

环丙沙星滴耳液[保(乙)]

Ciprofloxacin Ear Drops

【适应证】用于敏感菌所致的中耳炎、外耳道炎、鼓膜炎、乳突腔术后感染等。

【注意事项】(1) 本品一般用于中耳炎局限在中耳黏膜部位的局部治疗。若炎症已累及鼓室周围时，除局部治疗外，应同时服用抗生素。(2) 孕妇、哺乳期妇女慎用。一般不用于婴幼儿。(3) 出现过敏症状时应立即停药。(4) 本品疗程不宜超过4周。(5) 使用本品时若药温过低，可能会引起眩晕。因此，使用温度应接近体温。

【禁忌证】见9.3.14。

【不良反应】偶有中耳痛及瘙痒感。

【用法与用量】滴耳：成人一次6～10滴，儿童酌减，一日2～3次。滴耳后进行约10分钟耳浴。根据症状适当增减滴耳次数。

【制剂与规格】环丙沙星滴耳液：5 ml：15 mg。

14.1.6 软化耵聍药物

碳酸氢钠滴耳液

Sodium Bicarbonate Ear Drops

【适应证】用于外耳道耵聍栓塞。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】耵聍栓塞膨胀后，可引起外耳道疼痛、耳堵感。

【用法与用量】滴耳：成人一次2～3滴，儿童酌减，一日3～5次。

【制剂与规格】碳酸氢钠滴耳液：10 ml：0.5 g。

14.2 鼻疾病及其用药

14.2.1 鼻炎的药物治疗

鼻炎（rhinitis）是发生在鼻腔黏膜的炎性疾病。目前对鼻炎的判断主要依靠患者的鼻部症状，如鼻塞、流涕、鼻痒和喷嚏等。总体而言，鼻炎可以分为变应性鼻炎和非变应性鼻炎。由微生物感染引发的鼻黏膜炎症为感染性鼻炎，原则上属于非变应性鼻炎的范畴，由于临床常见而单列一类。

鼻减充血剂通常用于缓解鼻塞症状，但不宜长期使用。糖皮质激素具有显著的抗炎作用而被广泛用于鼻炎的治疗。感染性鼻炎可能需要使用抗菌药治疗。除药物治疗外，存在机械阻塞因素或结构异常的鼻炎通常需要手术干预。

• 变态反应性鼻炎（allergic rhinitis, AR）是体外环境因素作用于机体导致的鼻腔黏膜Th2免疫反应为主的变应性炎症反应。AR分为4型，由轻至重依次为：轻度间歇型、中重度间歇型、轻度持续型和中重度持续型。持续型AR患者的药物治疗方案的基本特征是阶梯性治疗，指在治疗随访过程中每2～4周根据疗效调整治疗方案，适当增减药物和剂量，对于间歇型AR患者，由于病程短暂，病症轻微，其治疗方案无阶梯性特征。

(1) 轻度间歇型AR：可选用抗组胺药（口服或鼻用）、鼻用减充血剂。其中鼻用减充血剂的疗程一般在7日以内，1个月内重复治疗不超过2次。

(2) 中重度间歇型AR：可选用抗组胺药（口服或鼻用）、鼻用糖皮质激素。不推荐肌内或鼻内注射糖皮质激素。

(3) 轻度持续型AR：首诊治疗方案基本与中重度间歇性AR相同，治疗2～4周后复诊，症状减轻或消失，应继续治疗或降低鼻用糖皮质激素剂量；症状持续或改善不满意，应采用鼻用糖皮质激素治疗或升级至中重度持续型AR治疗方案。

(4) 中重度持续型AR：首选鼻用糖皮质激素治疗，鼻塞症状严重时，可加用口服糖皮质激素或鼻用减充血剂。其中，口服糖皮质激素的疗程为1～2周；鼻用减充血剂的疗程不超过7日。治疗2～4周复诊，如症状无明显改善，应考虑以下因素的影响：①患者未遵从医嘱；②患者或医师应用药物剂量或次数不正确；③鼻塞妨碍药物向鼻内传输；④合并鼻息肉、鼻窦炎或鼻中隔偏曲；⑤患者持续暴露在含有大量抗原的环境中；⑥诊断有误。在确定诊断无误后，可做如下调整：

①鼻用糖皮质激素剂量加倍；②加用抗组胺药；③鼻用异丙托溴铵（ipratropium bromide）。其中，增加鼻用糖皮质激素剂量的目的是缓解鼻塞；抗组胺药用于控制鼻痒、喷嚏和流涕等变应性症状；异丙托溴铵用于控制流涕症状。当治疗显效时，应下调为轻度持续性 AR 的治疗方案，同时应考虑继续应用小剂量鼻用糖皮质激素维持疗效。整个疗程应至少在 3 个月以上（或整个花粉传播季节）。

14.2.2 鼻窦炎的药物治疗

鼻窦炎（rhinosinusitis）通常指鼻窦黏膜的化脓性炎症，可分为急性和慢性，以慢性多见。窦口引流和通气障碍是引起鼻窦炎发生的最重要机制。抗生素用于急性细菌性鼻窦炎和慢性鼻窦炎的急性发作或有化脓性并发症的病例。鼻用糖皮质激素具有收缩肿胀黏膜、抗炎抗水肿的作用，利于鼻窦通气和引流，是鼻窦炎药物治疗的主要用药。也可选用大环内酯类药物，小剂量（常规剂量的 1/2）长期口服，疗程不少于 12 周。黏液促排剂（如标准桃金娘油口服胶囊等）可稀释黏液、促进纤毛系统活性，有利于窦内分泌物的排出。氯化钠注射液用于冲洗置换治疗。鼻用减充血剂不适于长期使用，通常作为鼻腔检查或手术时的临时用药。非手术治疗无效者考虑鼻内镜手术治疗。

急性细菌性鼻窦炎：病原菌是导致急性细菌性鼻窦炎的直接致病因素，抗菌药治疗至关重要，其主要目的为缩短病程；使鼻窦恢复正常状态；预防出现严重的并发症；阻断疾病向慢性过程进展。需要注意的是，抗菌药的选择应基于明确诊断的基础（表 14-1，表 14-2），由于急性细菌性鼻窦炎通常继发于上呼吸道病毒性感染，过早应用抗菌药不但无益于控制病毒性感染，还可能导致增加控制细菌性感染的难度。

表 14-1 成人急性细菌性鼻窦炎口服抗菌药选择指南

患者分类	药物过敏	药物	推荐剂量
第一类	无β-内酰胺类药物过敏	阿莫西林／克拉维酸	500 mg/150 mg，一日 3 次
		阿莫西林	500 mg，8 小时 1 次
		头孢泊肟酯	100 mg，一日 2 次
		头孢呋辛酯	250 mg，一日 2 次
		头孢地尼	100 mg，一日 3 次
	β-内酰胺类药物过敏	甲氧苄啶／磺胺甲异噁唑	每片含磺胺甲噁唑 0.4 g 和甲氧苄啶 0.08 g，一次 1～2 片，一日 2～3 次
		多西环素	首日 200 mg，以后 100 mg，一日 1 次 （3～7 日）
		阿奇霉素	500 mg，一日 1 次
		地红霉素	600 mg，一日 1 次
		克拉霉素	250 mg，12 小时，1 次
		红霉素	250 mg，6 小时，1 次
第二类	无 β-内酰胺类药物过敏	左氧氟沙星	100 mg，一日 2 次
		莫西沙星	400 mg，一日 1 次
		阿莫西林／克拉维酸	一日 4 g/250 mg
		头孢曲松	一日 1 g
	β-内酰胺类药物过敏	加替沙星／左氧氟沙星／莫西沙星	一日 1 g
		克林霉素	300 mg，一日 2 次

第一类：症状轻微且过去 4～6 周未使用过抗菌药者；第二类：症状轻微但过去 4～6 周使用过抗菌药者或症状较重者

表 14-2 儿童急性细菌性鼻窦炎口服抗菌药选择指南

患者分类	药物过敏	可选药物
第一类	无 β 内酰胺类药物过敏	阿莫西林／克拉维酸（一日 90 mg/6.4 mg/kg）、阿莫西林（一日 90 mg/kg）、头孢泊肟酯、头孢呋辛酯、头孢地尼
	β－内酰胺类药物过敏	甲氧苄啶／磺胺甲异噁唑、阿奇霉素、克拉霉素、红霉素
第二类	无 β 内酰胺类药物过敏	阿莫西林／克拉维酸（一日 90 mg/6.4 mg/kg）、头孢曲松
	β－内酰胺类药物过敏	甲氧苄啶／磺胺甲异噁唑、阿奇霉素、克拉霉素、红霉素、克林霉素

第一类：症状轻微且过去 4 ～ 6 周未使用过抗菌药者；第二类：症状轻微但过去 4 ～ 6 周使用过抗菌药者或症状较重者

14.2.3 鼻科用糖皮质激素

鼻用糖皮质激素（glucocorticoid）是目前治疗鼻鼻窦炎最有效的药物之一。其主要药理学包括：①通过降低鼻黏膜炎症反应程度而缓解鼻塞；②脂溶性的糖皮质激素分子穿过靶细胞膜进入细胞质，与糖皮质激素受体结合，通过调节基因的转录，增加抗炎基因的转录和减少炎性基因的转录而发挥抗炎作用；③药物的生物利用度、肝脏首关代谢率、脂溶性和效价强度等药理学指标在一定程度上影响了药物的疗效和不良反应。

临床常用的丙酸倍氯米松、布地奈德、丙酸氟替卡松和糠酸莫米松等均属第二代鼻用糖皮质激素，其临床疗效已得到充分验证。

常规剂量的鼻用糖皮质激素，其安全性是有保障的：①对轴功能即下丘脑－垂体－肾上腺（hypothalamic-pituipary-adrenal，HPA）的影响不显著；②短期（数周）推荐剂量鼻内应用糖皮质激素产品对儿童生长影响不大。但超量或长期吸入糖皮质激素可能：①影响 HPA 轴功能，并抑制肾上腺功能；②抑制患儿生长速度。

应用中需注意：①对患者宣传，特别是药物的剂量和使用方法；②严格执行药物的推荐剂量，在控制症状的前提下，将药量降至最低；③最好一日早晨一次给药，最大限度地减少药物对 HPA 轴功能的影响；④联合吸入糖皮质激素治疗的患者，应酌情调整鼻用药物剂量；⑤治疗急性感染时（注意：急性感染为细菌感染时，应该加用抗生素），可先口服糖皮质激素或较大剂量的鼻用糖皮质激素控制症状，然后应用维持剂量的鼻用糖皮质激素（低量或中度量）；⑥对于规律的间歇性 AR，可预防性用药；⑦注意随访和相关科室的会诊，及时评估疗效并及早发现可能出现的全身和局部不良反应。

不良反应：常见的包括局部刺激、轻微血性分泌物、鼻出血、鼻干燥；极少数出现黏膜溃疡和鼻中隔穿孔。速发或迟发的过敏反应，包括荨麻疹、皮炎、血管神经性水肿和瘙痒；头痛、嗅觉、味觉紊乱、白内障和青光眼亦有可能发生。

丙酸倍氯米松鼻喷雾剂[保（乙）]

Beclomethasone Dipropionate Nasal Spray

【适应证】用于预防和治疗成人及 6 岁以上儿童常年性和季节性的过敏性鼻炎和血管运动性鼻炎。

【注意事项】(1) 肺结核、伴有疱疹和鼻部真菌感染的患者慎用。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 鼻腔和鼻旁窦伴有细菌感染时应给予抗菌治疗。(4) 已经全身应用糖皮质激素类药物并造成肾上腺功能损伤者，改用本品局部治疗时，也应注意检查垂体－肾上腺系统的功能。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 少数患者可出现鼻、

咽部干燥或烧灼感、喷嚏、味感和口感不佳或轻微鼻出血。(2) 极个别患者发生鼻中隔穿孔。(3) 罕见眼压升高或青光眼。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：成人及6岁以上儿童，一次每鼻孔100 μg，一日2次；或一次每鼻孔50 μg，一日3～4次。一日用量不可超过400 μg。

【制剂与规格】丙酸倍氯米松鼻喷雾剂：每喷50 μg，每支200喷。

布地奈德鼻喷雾剂[保(乙)]

Budesonide Nasal Spray

【适应证】(1) 用于预防治疗成人及6岁以上儿童季节性和常年性的变态反应性鼻炎，常年性非变态反应性鼻炎、鼻窦炎。(2) 用于预防鼻息肉切除后鼻息肉的复发，对症治疗鼻息肉。(3) 鼻内镜围手术期治疗。

【注意事项】(1) 肺结核、伴有鼻部真菌感染和疱疹的患者慎用。(2) 本品治疗时间不得超过3个月。(3) 长期使用高剂量治疗的儿童和青少年可能引起生长发育迟缓。(4) 本品仅用于鼻腔，不得接触眼睛，若接触眼睛，请立即用水清洗。(5) 应避免与酮康唑或其他强效的CYP3A4抑制剂合用。若无法避免，则给药间隔应尽可能长。(6) 孕妇不应使用本品，除非有特别考虑，目前尚无研究资料表明本品是否能进入母乳。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 局部症状，如鼻干、喷嚏。(2) 轻微的血性分泌物或鼻出血。(3) 皮肤反应，如荨麻疹、皮疹、皮炎、血管性水肿等。(4) 极少数患者发生溃疡和鼻中隔穿孔。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：①鼻炎。成人、6岁及6岁以上儿童，起始剂量一日256 μg（每个鼻孔64 μg），早晨一次喷入或分早、晚两次喷入。在获得预期效果后，减少用量至控制症状所需的最小剂量，如每天早晨每个鼻孔喷入64 μg。②鼻息肉。成人，一次128 μg（每个鼻孔64 μg），一日2次。

【制剂与规格】布地奈德鼻喷雾剂：每喷64 μg，每支120喷。

丙酸氟替卡松鼻喷雾剂[保(乙)]

Fluticasone Propionate Nasal Spray

【适应证】参见布地奈德鼻喷雾剂。4岁以上儿童亦可应用。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 应用本品数日后才能产生最大疗效。以早晨用药为宜。(3) 已经全身应用糖皮质激素类药物并造成肾上腺功能损伤者，改用本品局部治疗时，也应注意检查垂体-肾上腺系统的功能。(4) 经鼻腔用类固醇可引起全身作用，特别是在高剂量并长期使用时应予注意。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 局部症状，如鼻干、喷嚏。(2) 轻微的血性分泌物或鼻出血。(3) 皮肤反应，如荨麻疹、皮疹、皮炎、血管性水肿。(4) 极少数患者发生溃疡和鼻中隔穿孔。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：①成人和12岁以上儿童，一次每个鼻孔各100 μg，一日1～2次，一日最大剂量每个鼻孔一次200 μg。维持量一日1次，每个鼻孔各50 μg。②老年患者，用量同成年患者。③4～11岁儿童，一次每个鼻孔各50 μg，一日1～2次。一日最大剂量每个鼻孔一次100 μg。维持量应采用能够使症状得到有效控制的最小剂量。

【制剂与规格】丙酸氟替卡松鼻喷雾剂：每喷50 μg，每支60喷、120喷。

糠酸莫米松（糠莫米松）鼻喷雾剂[保(乙)]

Mometasone Furoate Aqueous Nasal Spray

【适应证】用于治疗成人和3岁以上儿童的季节性或常年性鼻炎。其他参见布地奈德鼻喷雾剂。3岁以上儿童亦可应用。

【注意事项】(1) 活动性或静止性呼吸道结核感染患者，未经治疗的真菌、细菌、全身性病毒感染患者，以及眼单纯疱疹患者慎用。(2) 孕妇慎用，在确有应用指征时，应权衡利弊后决定是否使用。哺乳期妇女用药期间宜暂停哺乳。(3) 对于

鼻黏膜局部感染未经治疗的患者不应使用本品。(4) 本品使用达数月或更长时间的患者，应定期检查鼻黏膜。(5) 如果鼻咽部发生局部真菌感染或持续存在鼻咽部刺激，本品应停用或给予适当治疗。(6) 接受本品治疗的患者，免疫功能可能受到抑制，有感染水痘、麻疹的危险。(7) 对于曾有中至重度季节性过敏性鼻炎症状的患者，应在花粉季节开始前 2 ~ 4 周用本品做预防性治疗。

【禁忌证】对本品所含成分（糠酸莫米松、聚山梨酯 -80、苯扎氯铵、苯乙醇等）过敏者禁用。

【不良反应】(1) 鼻出血，如明显出血、带血黏液和血斑，咽炎，鼻灼热感及鼻部刺激感。(2) 过敏反应和血管性水肿。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：①成人及 12 岁以上儿童，一次每侧鼻孔各 100 μg，一日 1 次。症状被控制后，剂量可减至一次每侧鼻孔各 50 μg。如症状未被有效控制，则剂量可增至一次每侧鼻孔 200 μg。② 3 ~ 11 岁儿童，一次每侧鼻孔各 50 μg，一日 1 次。

【制剂与规格】糠酸莫米松鼻喷雾剂：每喷 50 μg，每支 60 喷、120 喷。

曲安奈德鼻喷雾剂 [保(乙)]

Triamcinolone Acetonide Nasal Spray

【适应证】用于治疗和预防成人及 4 岁以上儿童的季节性或常年性变应性鼻炎。

【注意事项】(1) 呼吸道活动性结核病、未治疗的真菌病、全身性或病毒性感染、眼部单纯疱疹病毒感染等患者慎用。(2) 鼻中隔溃疡、鼻部手术或创伤后慎用。(3) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 鼻腔和鼻旁窦伴有细菌感染者，应同时进行抗菌治疗。(5) 已经全身应用糖皮质激素类药物并造成肾上腺功能损伤者，改用本品局部治疗时，也应注意检查垂体 - 肾上腺系统的功能。(6) 对严重过敏性鼻炎患者，尤其是伴有过敏性眼部功能损伤者，改用本品局部治疗时，也应同时接受其他药物治疗。(7) 一旦发生鼻、咽部白色念珠菌感染，停止使用本品，并给予适当的治疗。(8) 对部分患者而言，在治疗第 1 日症状会有所改善，但通常需经 1 周左右的治疗方可达到最大疗效。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【不良反应】(1) 鼻、咽部干燥或烧灼感，喷嚏或轻微鼻出血、头痛等。(2) 鼻分泌物呈黄色或绿色，有异味；鼻部或咽部有较严重的刺痛或流鼻血。(3) 罕见鼻中隔穿孔、眼压升高，通常见于曾做过鼻手术的患者。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：①成人和 12 岁以上儿童，一次每侧鼻孔各 110 μg，一日 1 次。当症状被控制时，用维持量，一次每侧鼻孔各 55 μg；如果症状未被有效控制，则剂量可增至一次每侧鼻孔各 220 μg，但一次总量不得超过 440 μg。② 4 ~ 12 岁的儿童，一次每侧鼻孔各 55 μg，一日 1 次。每日最大量，一次每侧鼻孔各 110 μg，一日 1 次。

【制剂与规格】曲安奈德鼻喷雾剂：每喷 55 μg，每支 120 喷。

14.2.4 鼻减充血药

鼻减充血药（topical nasal decongestant）是 α 肾上腺素受体激动药，可对鼻甲中的容量血管产生收缩作用，通过减少鼻黏膜中的血流而缓解鼻塞症状。鼻减充血药起效迅速，喷雾剂的药物分布效果强于滴鼻剂。常用者包括：0.5% 麻黄碱、0.05% 羟甲唑啉和 0.1% 塞洛唑林等。如果使用频率过高（间隔不足 3 小时）或疗程过长（3 周以上），可使鼻黏膜损伤导致药物性鼻炎，因此，对于以长期鼻塞为主要症状的患者，鼻减充血药并非适宜选择。

盐酸麻黄碱滴鼻液 [基(基)，保(甲)]

Ephedrine Hydrochloride Nasal Drops

【适应证】(1) 用于缓解鼻黏膜充血肿胀引起的鼻塞。(2) 用于鼻出血。

【注意事项】(1) 冠心病、高血压、甲状腺功能亢进、糖尿病、闭角型青光眼患者慎用。(2) 孕妇及儿童慎用。(3) 运动员慎用。(4) 鼻腔干燥者慎用。(5) 对

本品过敏者慎用。(6) 不与单胺氧化酶抑制药、三环类抗抑郁药同用。

【禁忌证】萎缩性鼻炎患者禁用。

【不良反应】偶见一过性轻微烧灼感，干燥感，头痛，头晕，心率加快，长期使用可致心悸，焦虑不安，失眠等。

【用法与用量】滴鼻：一次 1 ~ 2 滴，一日 3 ~ 4 次，连续使用不得超过 7 日。

【制剂与规格】盐酸麻黄碱滴鼻液：8 ml : 80 mg。

盐酸羟甲唑啉滴鼻液 [保(乙)]

Oxymetazoline Hydrochloride Nasal Drops

【适应证】用于急性鼻炎、慢性鼻炎、鼻窦炎、过敏性鼻炎。

【注意事项】高血压、冠心病、甲状腺功能亢进、糖尿病等患者慎用。

【禁忌证】萎缩性鼻炎、鼻腔干燥患者禁用。

【不良反应】(1) 滴药过频易致反跳性鼻充血，久用可致药物性鼻炎。(2) 轻微烧灼感，针刺感、鼻黏膜干燥以及头痛、头晕、心率加快等反应。

【用法与用量】滴鼻：一次 1 ~ 3 滴，早、晚各 1 次，每次间隔 4 小时以上，连续使用不得超过 7 日。

【制剂与规格】盐酸羟甲唑啉滴鼻液：① 3 ml : 1.5 mg；② 5 ml : 2.5 mg；③ 10 ml : 5 mg。

盐酸羟甲唑啉喷雾剂 [保(乙)]

Oxymetazoline Hydrochloride Spray

【适应证】用于急性鼻炎、慢性鼻炎、鼻窦炎、过敏性鼻炎。

【注意事项】高血压、冠心病、甲状腺功能亢进、糖尿病等患者慎用。

【禁忌证】(1) 鼻腔干燥、萎缩性鼻炎患者禁用。(2) 孕妇、哺乳期妇女及 3 岁以下小儿禁用。(3) 对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 喷雾过频易致反跳性鼻充血，久用可致药物性鼻炎。(2) 有轻微烧灼感，针刺感、鼻黏膜干燥以及头痛、头晕、心率加快等反应。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：成人和 6 岁以上儿童，1 次一侧鼻孔 37 ~ 111 μg (1 ~ 3 喷)，早晨和睡前各 1 次，连续使用不得超过 7 日。

【制剂与规格】盐酸羟甲唑啉喷雾剂：10 ml : 5 mg，每喷 37 μg。

复方盐酸羟甲唑啉气雾剂：本品主要成分为盐酸羟甲唑啉，辅料为硼酸、硼砂、氯化钠、防腐剂(三氯叔丁醇)。急性鼻炎、慢性单纯性鼻炎、肥厚性鼻炎和各种副鼻窦炎。吸入。

盐酸赛洛唑啉滴鼻液 [保(乙)]

Xylometazoline Hydrochloride Nasal Drops

【适应证】用于缓解急性鼻炎、慢性鼻炎、鼻窦炎等引起的鼻塞症状。

【注意事项】(1) 冠心病、高血压、甲状腺功能亢进、糖尿病、闭角型青光眼患者慎用。(2) 孕妇慎用。

【禁忌证】萎缩性鼻炎及鼻腔干燥患者禁用。

【不良反应】(1) 滴药过频易致反跳性鼻充血，久用可致药物性鼻炎。(2) 偶见一过性的轻微烧灼感，针刺感、鼻黏膜干燥及头痛、头晕、心率加快等反应。

【用法与用量】滴鼻：(1) 成人，0.1% 溶液，一次 2 ~ 3 滴，一日 2 次，连续使用不得超过 7 日。(2) 6 ~ 12 岁儿童，0.05% 溶液，一次 2 ~ 3 滴，一日 2 次，连续使用不得超过 7 日。

【制剂与规格】盐酸赛洛唑啉滴鼻液：① 5 ml : 5 mg (0.1%)；② 10 ml : 10 mg (0.1%)；③ 10 ml : 5 mg (0.05%)。

盐酸赛洛唑啉喷鼻液

Xylometazoline Hydrochloride Nasal Spray

【适应证】用于急性鼻炎、慢性鼻炎、鼻窦炎、过敏性鼻炎、肥厚性鼻炎等鼻腔疾病的鼻塞症状。

【注意事项】(1) 冠心病、高血压、甲状腺功能亢进、糖尿病、闭角性青光眼患者慎用。(2) 6 岁以下儿童慎用。

【禁忌证】(1) 接受单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药治疗的患者禁用。(2) 2 岁以下儿童禁用。(3) 对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见鼻腔内一过性轻微灼烧感、干燥感、头痛、头晕及心率加快等。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：一次125 ~ 187.5 μg（2 ~ 3 喷），一日 2 次，连续使用不得超过 7 日。

【制剂与规格】盐酸赛洛唑啉喷鼻液：10 ml ∶ 5 mg，每喷 62.5 μg，每支 64 喷。

14.2.5 鼻变态反应的药物治疗

14.2.5.1 抗组胺药

抗组胺药主要用于治疗变应性鼻炎，可控制鼻痒、喷嚏和流涕等变应性症状。（其他见 2.6）

氮䓬斯汀鼻喷剂[保（乙）]

Azelastine Nasal Spray

【适应证】用于季节性过敏性鼻炎（花粉症）和常年性过敏性鼻炎。

【注意事项】妊娠初始 3 个月内妇女慎用。

【禁忌证】（1）哺乳期妇女禁用。（2）6 岁以下儿童禁用。

【不良反应】（1）鼻黏膜刺激，鼻出血。（2）若给药方法不正确（如头部后仰），用药时会有苦味感，偶见恶心。

【用法与用量】鼻腔喷雾吸入：成人，一次每鼻孔各 140 μg（2 喷），一日 2 次（早、晚各 1 次，相当于一日 560 μg），连续使用不超过 6 个月。

【制剂与规格】氮䓬斯汀鼻喷剂：每喷 70 μg，每支 10 ml（10 mg）。

14.2.5.2 白三烯受体拮抗药

白三烯 D_4 可使患者鼻塞症状加重，鼻科抗白三烯治疗的主要目的是缓解患者的鼻塞症状，且有抗炎作用，治疗的不良反应少。（其他见 2.5.2）

孟鲁司特钠[保（乙）] 用于减轻季节性过敏性鼻炎引起的症状。口服。① 15 岁及 15 岁以上成人，一次 10 mg，一日 1 次，睡前服用。② 6 ~ 14 岁儿童，一次 5 mg，一日 1 次，睡前服用咀嚼片。③ 2 ~ 5 岁儿童，一次 4 mg，一日 1 次，睡前服用咀嚼片。（其他见 2.5.2）

14.2.5.3 抗胆碱类药

抗胆碱类药（antimuscarinic）通过阻止乙酰胆碱和毒蕈碱受体药物相互作用，达到减少腺体分泌的目的。（其他见 2.3.2）

14.2.5.4 抗过敏药

抗过敏药通过稳定肥大细胞膜，抑制其释放组胺、白三烯、5- 羟色胺、缓激肽及慢反应物质等致敏介质，从而预防过敏反应的发生。（其他见 2.5.1）

色甘酸钠[保（乙）]

Sodium Cromoglicate

【适应证】用于防治过敏性鼻炎。

【注意事项】严重肝、肾功能不全患者慎用。

【禁忌证】妇女妊娠初期（1 ~ 3 个月）禁用。

【不良反应】（1）使用滴鼻液时，可见鼻刺痛、烧灼感、喷嚏、头痛、嗅觉改变，罕见鼻出血、皮疹等过敏反应。（2）干粉吸入时，少数患者有咽部刺激感、呛咳、恶心、胸闷反应，系由粉末的刺激所致。也有在治疗数周后症状加重，或出现皮疹、排尿困难。

【用法与用量】（1）色甘酸钠滴鼻液：滴入鼻内一次 5 ~ 6 滴，一日 5 ~ 6 次。（2）吸入用色甘酸钠胶囊：干粉（胶囊）鼻吸入，每侧 10 mg（半粒），一日 4 ~ 6 次。

【制剂与规格】色甘酸钠滴鼻液：10 ml ∶ 0.2 g。

吸入用色甘酸钠胶囊：20 mg。

（其他见 2.5.1）

14.2.6 黏液促排药

黏液促排药在上、下呼吸道黏膜均能迅速发挥溶解黏液、调节分泌的作用，并主动刺激黏液纤毛运动，增强黏液纤毛清除功能。黏液运转速度的显著增加，也有助于黏液排出。（其他见 2.1.1）

标准桃金娘油胶囊[保（乙）] 用于急性鼻窦炎、慢性鼻窦炎和支气管炎。口服：（1）成人常用量。①急性患者，一次 300 mg，一日 3 ~ 4 次。②慢性患者，一次 300 mg，一日 2 次。（2）儿童（4 ~ 10 岁）

常用量。①急性患者，一次 120 mg，一日 3 ~ 4 次。②慢性患者，一次 120 mg，一日 2 次。(其他见 2.11)

14.3 咽喉疾病及其用药

急性扁桃体炎 (acute tonsillitis) 为腭扁桃体 (常称扁桃体) 的急性非特异性炎症。本病具有传染性，故患者要适当隔离。全身应用抗生素，首选青霉素。可配合应用清热解毒的中成药或汤剂。局部常用含漱液 (含盐漱口水、复方硼砂溶液、复方氯己定溶液、1% 过氧化氢溶液、呋喃西林漱口片) 漱口。咽痛较剧或高热时，可口服解热镇痛药。注意休息。加强营养，进易消化的流食或软食，补充维生素，多饮水。疏通大便。本病反复发作，特别是已有并发症者，应在急性炎症消退后施行扁桃体切除术。

慢性咽炎 (chronic pharyngitis) 为咽部黏膜、黏膜下及淋巴组织的弥漫性炎症，多见于成年人。有单纯性、肥厚性及萎缩性之分。该病病程长，症状顽固，较难治愈，应积极寻找病因和诱因。常采用中医中药治疗。含片 (西地碘、度灭芬喉片、溶菌酶、地喹氯铵、薄荷含片等) 可缓解不适症状。用漱口液 (复方硼砂溶液、复方氯己定) 漱口。用咽部涂抹的制剂 (2% 碘甘油、硼酸甘油) 涂抹咽部。服用维生素 A、维生素 B_2、维生素 C、维生素 E 等。

急性喉炎 (acute laryngitis) 是喉黏膜的急性炎症。治疗期间，少讲话使声带休息是首要条件。病情较重，有细菌感染时可全身应用抗生素和糖皮质激素。行超声雾化吸入 (布地奈德雾化混悬液)。也可在热水内加入 (复方安息香酊等) 药物，慢慢吸入。局部理疗也有帮助。中药对急性喉炎有一定的疗效。

14.3.1 含漱液或含漱片

含漱液一般采用药物的水溶液。一日多次，一次含入约 10 ml，仰头含漱大约 1 分钟后吐出。也可用温开水制成含盐漱口水，一日多次漱口，直至症状改善。

复方硼砂溶液 [保(甲)]

Compound Borax Solution

【适应证】用于口腔炎、咽喉炎与扁桃体炎等。

【注意事项】(1) 含漱后应吐出，不可咽下。(2) 儿童、老年人、孕妇及哺乳期妇女慎用。(3) 本品误服后可引起局部组织腐蚀，吸收后可发生急性中毒，早期症状为呕吐、腹泻、皮疹以及中枢神经系统先兴奋后抑制等症状。(4) 用时应避免接触眼睛。

【禁忌证】新生儿、婴儿禁用。

【用法与用量】含漱：一次 10 ml，加 5 倍量的温开水稀释后含漱，一次含漱 5 分钟后吐出，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】复方硼砂溶液：每 100 ml 含硼砂 1.5 g、碳酸氢钠 1.5 g、液化酚 0.3 ml、甘油 3.5 ml。

复方硼砂漱口片

Compound Borax Tablets

【适应证】【注意事项】【禁忌证】见复方硼砂含漱液。

【用量与用法】漱口：一次 1 片，加入温开水 60 ~ 90 ml，溶后含漱，一日 4 ~ 6 次。

【制剂与规格】复方硼砂漱口片：每片 0.65 g 含硼砂 0.324 g、碳酸氢钠 0.162 g、氯化钠 0.162 g、麝香草酚 0.003 2 g。

复方氯己定含漱液

Compound Chlorhexidine Gluconate Gargle Solution

【适应证】用于牙龈炎、冠周炎、口腔黏膜炎等引致的牙周脓肿、口腔黏膜溃疡等病症的辅助治疗。

【注意事项】(1) 本品连续使用不宜超过 3 个疗程。(2) 含漱时至少在口腔内停留 2 ~ 5 分钟。(3) 本品仅供含漱用，含漱后吐出不得咽下。(4) 用时应避免药液接触眼睛。(5) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(6) 使用本品期间，如另外再用其他类口腔含漱液时，应至少间隔 2 小时。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 偶见过敏反应或口腔黏膜浅表脱屑。(2) 长期使用能使口腔黏膜表面与牙齿着色，舌苔发黄，味觉改变。

【用法与用量】漱口：一次 10~20 ml，一日 2 次，早、晚刷牙后含漱，5 ~ 10 日为 1 个疗程。

【制剂与规格】复方氯己定含漱液：每 500 ml 含葡萄糖酸氯己定 0.6 g、甲硝唑 0.1 g。

过氧化氢溶液[保(乙)]

Hydrogen Peroxide Solution

【适应证】用于扁桃体炎、口腔炎、白喉等。

【注意事项】(1) 本品遇光、热易分解变质。(2) 本品所用 1%浓度的溶液，系用市售 3%过氧化氢溶液加水适量稀释制得。

【不良反应】(1) 高浓度对皮肤和黏膜产生刺激性灼伤，形成一疼痛“白痂”。(2) 以本品连续应用漱口可产生舌乳头肥厚，属可逆性。(3) 本品溶液灌肠时，当含过氧化氢 (H_2O_2) 浓度 $\geqslant$ 0.75%可发生气栓和（或）肠坏疽。

【用法与用量】漱口：根据情况一日多次。

【制剂与规格】过氧化氢溶液：1%。

呋喃西林漱口片

Nitrofural Tablets

【适应证】用于咽喉炎、扁桃体炎及口腔炎等。

【注意事项】(1) 发生过敏反应，应立即停止使用。(2) 含漱后吐出不得咽下。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】漱口：一次 50 mg，一日 4 ~ 6 次。临用前，将本品 50 mg 加入温开水 500 ml 使其溶解。

【制剂与规格】呋喃西林漱口片：50 mg。

14.3.2 含片

将药片含在口中，待逐渐溶化后咽下，使药物直接作用于口腔及喉咽部黏膜发挥其药理作用。

西地碘含片

Cydiodine Buccal Tablets

【适应证】用于慢性咽喉炎、口腔溃疡、慢性牙龈炎、牙周炎。

【注意事项】(1) 妊娠及哺乳期妇女慎用。(2) 本品应逐渐含化，勿嚼碎口服。(3) 甲状腺疾病患者慎用。正在测试甲状腺功能的患者应考虑本品对检验结果的影响。(4) 连续应用 3 ~ 5 日，症状未见缓解者，应停药就医。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者或对其他碘制剂过敏者禁用。(2) 孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】(1) 偶见皮疹、皮肤瘙痒等过敏反应。(2) 长期含服可导致舌苔染色，停药后可消退。

【用法与用量】口含：一次 1.5 mg，一日 3 ~ 5 次。

【制剂与规格】西地碘含片：1.5 mg。

度米芬喉片

Domiphen Bromide Tablets

【适应证】用于咽喉炎、扁桃体炎。

【注意事项】本品应逐渐含化，勿嚼碎口服。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】口含：一次 0.5 ~ 1 mg，每 2 ~ 3 小时一次。

【制剂与规格】度米芬喉片：0.5 mg。

溶菌酶含片

Lysozyme Buccal Tablets

【适应证】用于急性咽喉炎，慢性咽喉炎，口腔黏膜溃疡及咳痰困难。

【注意事项】(1) 本品应逐渐含化，勿嚼碎口服。(2) 连续使用 5 日后炎症仍未消除者，应向医师咨询。

【不良反应】偶见过敏反应、皮疹等。

【用法与用量】口含：一次 1 片，一日 4 ~ 6 次。

【制剂与规格】溶菌酶含片：20 mg。

地喹氯铵含片 用于急性咽喉炎，慢性咽喉炎，口腔黏膜溃疡、齿龈炎。口含，一次 1 ~ 2 片，每 2 ~ 3 小时 1 次，必要时

可重复用药。(其他见 15.4.1.3)

薄荷喉片

Menthol Buccal Tablets

【适应证】用于咽喉炎、扁桃体炎及口臭等。

【注意事项】本品应逐渐含化，勿嚼碎口服。

【禁忌证】对本品中成分过敏者禁用。

【不良反应】少见，偶可发生哮喘，荨麻疹和血管性水肿等变态反应。

【用法与用量】口含：一次含 1 片，并徐徐咽下，一日 4 ~ 6 次。

【制剂与规格】本品为复方制剂。每片重 0.42 g，含活性成分为：薄荷脑 2 mg、苯甲酸钠 5 mg、三氯叔丁醇 0.6 mg、桉叶油 0.6 mg、八角茴香油 0.8 mg。

14.3.3 用于咽部涂抹的制剂

碘甘油 用于慢性咽炎、口腔黏膜溃疡、牙龈炎及冠周炎。外用用棉签蘸取少量本品涂于患处，一日 2 ~ 4 次。(其他见 15.4.1.1)

硼酸甘油液

Boracic Acid and Glycerin Solution

【适应证】用于急性咽炎、慢性咽炎。

【禁忌证】对本品中成分过敏者禁用。

【用法与用量】外用，用棉签蘸取少量本品涂于患处，一日 3 次。

【制剂与规格】硼酸甘油液：50%：硼酸 50 g，甘油 100 g。

14.3.4 喷雾法和熏气法用药

喷雾法是用压缩空气等方法使药液雾化，喷入咽部；熏气法是将带药的蒸气吸入咽部，发挥治疗作用。常用的药物如抗生素、肾上腺皮质激素等。

复方安息香酊[保(乙)]

Compound Benzoin Tincture

【适应证】用于急性咽炎，急性喉炎，慢性喉炎，气管炎等。

【注意事项】(1) 避免接触眼睛和其他黏膜（如口、鼻等)。(2) 用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净。(3) 不宜用于破损皮肤。(4) 不宜长期大面积使用。(5) 用药后应立即洗手。(6) 对本品过敏者禁用，过敏体质者慎用。

【禁忌证】对本品中成分过敏者禁用。

【不良反应】有轻微刺激性。

【用法与用量】(1) 蒸气吸入：一次 2 ~ 4 ml，一日 2 ~ 3 次。临用时，按规定量将本品加入沸水 500 ~ 1 000 ml 的广口杯中，用毛巾围住杯口，使热气集中于患者口、鼻，吸入带药蒸气 10 ~ 20 分钟。(2) 喷雾法：一次 2 ~ 4 ml，一日 3 ~ 4 次，必要时每小时 1 次。临用时，按规定量将本品加入 40 ~ 50 ml 蒸馏水中，通过蒸气吸入器吸入喷出的药雾 20 ~ 30 分钟。

【制剂与规格】复方安息香酊：本品为复方制剂，每 100 ml 含安息香 10 g、苏合香 7.5 g、妥路脂 2.5 g，芦荟粉 2 g。

第15章 口腔科疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 疱疹性口炎
- 念珠菌口炎
- 鹅口疮
- 抗生素口炎
- 念珠菌白斑
- 义齿性口炎
- 口角炎
- 急性坏死溃疡性龈炎
- 牙周炎
- 牙周脓肿
- 急性化脓性根尖周炎
- 冠周炎
- 复发性口腔溃疡
- 创伤性溃疡

感染性疾病是口腔科最常见疾病，疱疹性口炎、急性坏死性溃疡性龈炎、急性化脓性根尖周炎和冠周炎是最常见的急性感染。口腔两大疾病龋齿和牙周病都是慢性感染性疾病。口腔急性感染需要使用全身抗感染药物治疗。口腔临床治疗中常常需要局部用药，许多慢性感染无需全身用药，仅局部用药即可。不同的抗感染药可制成含漱剂、膜剂、膏剂、口含片，并可制成缓释剂型。除用于黏膜表面外，还可用于牙髓腔、牙周袋，多种缓释剂已成功应用于牙周炎治疗。由于口腔环境复杂，许多因素影响抗感染药物的疗效。牙菌斑生物膜的结构使生存于其中的微生物对药物和宿主的防御机制有较高的抵抗性。因此在用药时，应先尽可能彻底地去除感染部位的微生物，如牙菌斑、牙石、感染坏死的牙髓组织、溃疡表面的渗出物等，使药物直接作用于感染部位。抗感染药物也不宜长期使用，因为口腔是有菌环境，牙菌斑在牙面上不断形成，如果不定时清除牙菌斑一旦停药，疾病还会复发，长期用药还易导致细菌耐药。

15.1 口腔感染性疾病用药

15.1.1 口腔病毒性感染用药

疱疹性口炎（herpetic stomatitis）是口腔常见的病毒性口炎。原发性疱疹性龈口炎，常见于婴幼儿。患者表现为口腔黏膜充血水肿，特别是牙龈充血水肿明显，黏膜出现簇集性小水疱，小疱破裂后形成浅溃疡。

口腔局部选用氯己定、聚维酮碘、依沙吖啶或复方硼酸溶液漱口。可用氯己定、溶菌酶、西地碘片等含化。唇疱疹局部用阿昔洛韦、喷昔洛韦软膏或酞丁安乳膏局部涂布。唇疱疹继发感染时，可用温的生理盐水、依沙吖啶或氯己定溶液湿敷。

全身抗病毒治疗可选用利巴韦林、阿昔洛韦、伐昔洛韦、泛昔洛韦和更昔洛韦的口服制剂。

15.1.2 口腔真菌性感染用药

口腔真菌性感染疾病治疗用药基本相同，除局部用药外，可根据感染情况选用全身抗真菌药物治疗。与真菌感染有关的口腔疾病如下。

15.1.2.1 念珠菌口炎

念珠菌口炎（candidal stomatitis）是常见的口腔真菌感染，是念珠菌属感染所引起的急性、亚急性或慢性口腔黏膜疾病。口腔念珠菌病中白色念珠菌是最主要的病原菌。

15.1.2.2 鹅口疮

鹅口疮（thrush）常发生于新生儿、艾滋病和长期使用皮质激素的患者。好发部位为颊、舌、软腭及唇，损害区黏膜充血，可见白色丝绒状斑片。

15.1.2.3 抗生素口炎

抗生素口炎（antibiotic stomatitis）多见于成年人，与长期应用广谱抗生素有关，且大多数患者原患有消耗性疾病，如白血病、营养不良、内分泌紊乱、肿瘤化疗后等。以舌黏膜多见，主要表现为黏膜充血、糜烂及舌背中部乳头萎缩。

15.1.2.4 念珠菌白斑

念珠菌白斑（candidal leukoplakia）常见于口角联合区、颊黏膜、舌背及腭部，常表现为颗粒状白色斑块。此型患者应警惕癌变。吸烟的患者应该戒烟。

15.1.2.5 义齿性口炎

义齿性口炎（denture stomatitis）多发生于戴义齿的患者。损害部位常在上颌义齿侧面接触的腭、龈黏膜，表现为义齿承托区黏膜广泛发红，形成鲜红色弥散红斑，红斑表面可有颗粒增生。

局部治疗：用碳酸氢钠溶液含漱，甲紫溶液及制霉菌素糊剂局部涂布。

全身抗真菌药物治疗可选用咪康唑、克霉唑及氟康唑。对氟康唑耐药的感染可选用伊曲康唑治疗。

15.1.2.6 口角炎

口角炎（angular cheilitis）是发生于口角区的炎症总称，以皲裂、糜烂和结痂为主要症状。多由维生素缺乏，细菌和真菌感染引起。老年患者口角炎多与咬合垂直距离缩短有关，口角区皮肤发生塌陷呈沟槽状，导致唾液由口角溢入沟内，故常呈潮湿状态，有利于真菌生长繁殖。

局部治疗：口角区病损用依沙吖啶、氯己定溶液湿敷，去除痂皮后，涂布甲紫溶液。在渗出不多无结痂时，可用金霉素软膏局部涂布。对真菌性口角炎可加用咪康唑软膏。针对引起感染性口角炎的诱因，应采取措施加以消除。例如：纠正过短的殆间距离，修改不良修复体，增加殆垫，制作符合生理殆间距离的义齿，减少口角区皱褶，保持口角区干燥。

15.1.3 口腔细菌感染性疾病用药

15.1.3.1 急性坏死溃疡性龈炎

急性坏死溃疡性龈炎（acute necrotizing ulcerative gingivitis）是局限于牙龈的坏死性炎症。重度患者可有颌下淋巴结肿大和触痛，涎液增多，低热等症状。坏死区涂片瑞氏染色可见大量的梭形杆菌和螺旋体。

治疗主要采取局部处理：轻轻去除大块牙结石，用3%过氧化氢溶液擦洗。并

给予氯己定溶液含漱。重症者可口服硝基咪唑类药物。

15.1.3.2 牙周炎

牙周炎（periodontitis）是由牙菌斑中的微生物所引起的牙周支持组织的慢性感染性疾病，导致牙周支持组织的炎症和破坏。以局部治疗为主，采用洁治术、龈下刮治和根面平整术清除局部致病因素，治疗后可用3%过氧化氢溶液或氯己定溶液局部冲洗。同时要指导患者采用正确的方法刷牙、使用牙线或牙签或牙间隙刷，以长期控制牙菌斑，保持口腔卫生。重度慢性牙周炎、侵袭性牙周炎、伴糖尿病等全身疾病的牙周炎患者需辅助全身用药和局部药物治疗，可选用的药物如硝基咪唑类、四环素类。局部用氯己定、西吡氯铵溶液含漱等；侵袭性牙周炎的患者采用硝基咪唑类与阿莫西林联合用药。

糠甾醇（牙周宁）[保（乙）]

Rice Bran Sterol

【适应证】用于牙周脓肿、牙龈出血等牙病。

【注意事项】（1）牙周炎症状控制后需继续服用一定时期的维持量以巩固疗效。（2）本品虽有治疗牙周病的作用，但须与牙周病局部治疗同时进行，方能根治牙周病。（3）妊娠及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】尚未见有关不良反应的报道。

【用法用量】口服：治疗量，一次240～320 mg，一日3次；维持量，一次80～160 mg，一日3次。

【制剂与规格】糠甾醇片：40 mg。

15.1.3.3 牙周脓肿

牙周脓肿（periodontal abscess）是位于牙周袋壁或深部牙周组织中的局限性化脓性炎症，一般为急性过程，也可为慢性牙周脓肿。

治疗原则是止痛、防止感染扩散以及使脓液引流。在脓肿初期脓液尚未形成前，可清除大块牙石，冲洗牙周袋，将碘甘油引入袋内，必要时全身给予抗菌药物或支持疗法。当脓液形成出现波动时，可根据脓肿的部位及表面黏膜的厚薄，选择从牙周袋内或牙龈表面引流。袋内引流可用尖探针从袋内壁刺入脓腔，切开引流可在表面麻醉下进行，用尖刀片切开脓肿达深部，切开后用氯化钠溶液彻底冲洗脓腔，然后局部使用碘甘油。切开引流后的数日内应让患者用氯己定溶液含漱。

局部用药：氯己定、西吡氯铵、过氧化氢、聚维酮碘溶液、米诺环素软膏。

重度牙周脓肿、多发性牙周脓肿，应使用全身药物治疗，可用硝基咪唑类、四环素类，也可硝基咪唑类与阿莫西林联合应用。

15.1.3.4 急性化脓性根尖周炎

急性化脓性根尖周炎（acute apical periodontitis）发生于根尖周围组织的急性化脓性炎症性疾病。根据脓肿所在的部位分为：根尖脓肿、骨膜下脓肿和黏膜下脓肿3个阶段。

治疗首先要开髓、拔髓、开放引流，迅速消除急性炎症。当移行沟变平有明显波动感时脓肿切开引流。同时全身给予硝基咪唑类、青霉素类、头孢菌素类抗菌药物。疼痛的患者可给予氨酚待因等止痛药。

15.1.3.5 冠周炎

冠周炎（pericoronitis）正常萌出或阻生的牙齿，在萌出的过程中牙冠周围软组织发生的炎症，称为冠周炎。其中以下颌第三磨牙的冠周炎最为常见。好发于18～30岁的年轻人，是口腔科的常见病和多发病。

冠周炎常以急性炎症的形式出现。急性发作可以分为两型，局限型和扩散型。当感染向邻近潜在的间隙扩散时，可发生蜂窝织炎、扁桃体周围脓肿、急性化脓性淋巴结炎，甚至颌骨骨髓炎、败血症和脓毒血症等严重并发症。对于局限型冠周炎强调及时的局部处理。用过氧化氢、氯化钠、氯己定溶液反复冲洗，清除龈袋内的食物碎屑、坏死组织和脓液，擦干局部，用探针蘸碘甘油导入龈袋内，一日2～3次。用呋喃西林或氯己定溶液漱口。

对于扩散型冠周炎除局部处理外，应根据分泌物的细菌学检查选择合适的抗菌药物和全身支持治疗，可口服或静脉输入抗生素，如青霉素类、大环内酯类或头孢菌素类等。龈瓣附近形成脓肿时应及时切开引流，放置引流条。

急性炎症得到有效控制后，应及时处理病灶牙，如手术消除盲袋，牙齿导萌，拔除阻生牙，切除瘘管，刮尽肉芽等。

15.2 口腔溃疡用药

15.2.1 复发性口腔溃疡

复发性口腔溃疡（recurrent aphthous ulcer，RAU）是最常见的口腔黏膜溃疡性疾病，具有周期性复发性和自限性特征。根据溃疡和数目分为轻型、口炎型和重型复发性口腔溃疡。

局部治疗主要是消炎、止痛、促溃疡愈合。可选用氯己定、聚维酮碘、依沙吖啶、西吡氯铵、复方硼砂溶液漱口。溶菌酶、地喹氯铵、西地碘片含化。

止痛可选用复方甘菊利多卡因凝胶于溃疡局部涂布。促溃疡愈合可局部外用重组人表皮生长因子。

深大的重型复发性口腔溃疡，可用曲安奈德混悬液或醋酸泼尼松龙混悬液 0.5 ~ 1 ml，加入2%普鲁卡因 0.3 ~ 0.5 ml 在溃疡基底部注射，每周 1 次。

15.2.2 创伤性溃疡

创伤性溃疡（traumatic ulceration）是由于长期慢性机械刺激或压迫而产生的口腔软组织损害。特点是慢性、深大的溃疡，周围有炎症增生反应，黏膜水肿明显。多数由口内持久的机械刺激，如残冠、残根、不良修复体、锐利的牙齿边缘等。溃疡发生在邻近或接触刺激因子的部位，其形态常常能与刺激因子相契合。

治疗首先立即去除刺激因素，如拔除残根、残冠、磨改过陡的牙尖，拆除不良修复体。用氯己定、聚维酮碘、依沙吖啶、西吡氯铵溶液含漱。溶菌酶、地喹氯铵、西地碘片含化。

注意若除去病因仍不能在短期内愈合，则应做病理检查与癌及结核性溃疡鉴别。

15.3 口腔干燥用药

口腔干燥（xerostomia）常见于头颈部区域放射治疗后和舍格伦综合征。舍格伦综合征是自身免疫病，最常见症状是口、眼干燥，同时可累及肾、肺、甲状腺和肝等多种器官。由于缺乏涎液的清洁、稀释和缓冲作用，造成食物和口腔微生物在牙面堆积，引起严重的进行性龋病，牙齲坏多发生在牙颈部，形成环状齲。常伴有白色念珠菌感染。口腔干燥还常见于药物不良反应，如解痉药、三环抗抑郁药。

口腔干燥对症治疗可选用人工涎液。乙基纤维素和黏液素可长期增加口腔表面润湿和润滑作用，已被广泛应用；另外，还有以多聚氧化乙烯和亚麻子多糖提取剂等增稠剂为基础的涎液替代品；多聚甘油甲基丙烯酸酯口腔润湿胶可起到润湿和预防齲齿的两重作用。也可口含 1%～2% 枸橼酸液或维生素 C 片，增加涎液分泌。剩余腺体的刺激多数采用 M 受体激动药，如毛果芸香碱、西维美林，对各期患者均有较好的疗效，用药后可明显改善患者的口干和眼干症状。茴三硫也可用于治疗舍格伦综合征的口干症状，但只对早期患者有作用，对腺体破坏严重的中晚期患者几乎无作用。

茴三硫 用于治疗舍格伦综合征（口、眼、鼻干燥综合征）的干燥症状，纠正因服用某些药品（如镇静催眠药抗抑郁药、抗帕金森病药）引起的药源性及口咽区接受放射性治疗后引起的口干症。口服：一次 25 mg，一日 3 次。（其他见 3.12）

15.4 口腔局部常用制剂及局部麻醉药物

15.4.1 局部常用制剂

15.4.1.1 漱洗剂及湿敷剂

漱洗剂及湿敷剂是指根据临床需要将不同药物配制成液体制剂，用于漱洗或湿敷，以改变口腔内外环境，直接或间接抑制口腔内及其周围细菌的生长繁殖、减少

口腔细菌的数量。

氯己定

Chlorhexidine

【适应证】适用于牙龈炎、冠周炎、口腔黏膜炎等所致的牙龈出血、牙周肿痛及溢脓性口臭、口腔溃疡等症的辅助治疗用药。

【注意事项】(1) 连续使用不宜超过3个疗程。(2) 含漱时至少在口腔内停留2～5分钟。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 偶见过敏反应或口腔黏膜浅表脱屑。(2) 长期使用能使口腔黏膜表面与牙齿着色，舌苔发黄、味觉改变，停药后可恢复。义齿因表面粗糙可发生永久性着色。

【用法与用量】(1) 含漱：一次10～15 ml，早、晚刷牙后含漱2～5分钟，5～10日为1个疗程。(2) 湿敷：将浸有本品的消毒纱布覆盖于局部损害处数分钟，一日2～3次。(3) 含化：一次1片，一日4～6次。

【制剂与规格】葡萄糖酸氯己定片：5 mg。

氯己定溶液：0.02%～0.2%。

复方氯己定溶液：每500 ml含葡萄糖酸氯己定0.6 g、甲硝唑0.1 g。

过氧化氢溶液[保(乙)]

Hydrogen Peroxide Solution

【适应证】用于辅助治疗急性坏死性溃疡性龈炎、牙周炎及冠周炎等。

【注意事项】长期使用本品含漱，应与碳酸氢钠溶液交替使用，以中和其酸性。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 高浓度对皮肤和黏膜产生刺激性灼伤，形成疼痛性“白痂”。(2) 连续应用漱口可产生舌乳头肥大，属可逆性。

【用法与用量】(1) 含漱：1.5%溶液，一次10～15 ml，一日含漱3～4次。(2) 冲洗：3%溶液，龈袋或牙周袋冲洗。

【制剂与规格】过氧化氢溶液：① 1%；② 3%。

依沙吖啶[保(乙)] 用于口腔、外伤及感染创面的消毒与湿敷。0.1%溶液可用于含漱，一次10～15 ml，一日3～4次。(其他见16.3.2)

碳酸氢钠[基(基)，保(甲)]

Sodium Bicarbonate

【适应证】(1) 口腔念珠菌病。(2) 辅助治疗久治难愈的口腔黏膜病损如天疱疮、糜烂性口腔扁平苔藓等。(3) 预防由放射治疗、化学治疗、长期使用抗生素、糖皮质激素等所引起的口腔黏膜损害；与氯己定溶液交替使用，效果更佳。(4) 用于涎液黏稠的黏膜溃疡，糖尿病患者用于预防真菌感染。

【注意事项】使用本品含漱时，不能因味涩而再用清水漱口。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】服用本品中和胃酸时所产生的二氧化碳可能引起嗳气、继发性胃酸分泌增加。

【用法与用量】(1) 含漱：成人，2%～4%溶液，一次10～15 ml，一日3～4次。(2) 轻型小婴儿，可用2%溶液擦洗口腔，一日3～4次。(3) 婴幼儿患者，哺乳前后用2%溶液洗涤口腔，用4%溶液洗涤产妇乳头，再用清水洗净。还可用于浸泡奶瓶等哺乳用具。(4) 4%溶液用于浸泡义齿。

【制剂与规格】碳酸氢钠片：0.5 g。

碳酸氢钠溶液：4%。

(其他见11.3.2)

聚维酮碘溶液

Povidone Iodine Solution

【适应证】用于口腔黏膜创伤、溃疡及病毒、细菌所致的口腔黏膜病；拔牙及口腔外科手术前后消毒；牙髓及根尖周病治疗中的冲洗和封药；以及日常漱口消毒。

【注意事项】(1) 涂布部位如有灼烧感、瘙痒、红肿等情况，应停止用药，并将局部药物洗净，必要时向医师咨询。(2) 如误服中毒，应立即用淀粉糊或米汤洗胃，并送医院救治。

【禁忌证】对碘过敏者。

【不良反应】偶见过敏反应和皮炎。

【用法与用量】(1) 用于治疗时，可用棉签蘸原液直接涂布于患处，一日1～2次。(2) 含漱消毒，可将药液用凉开水稀释1～2倍，一次5～10 ml，一日2～3次，每次含漱1分钟后吐出，半小时内不饮水和进食。(3) 用于活动义齿夜间浸泡清洁时，可将原液稀释10倍。

【制剂与规格】聚维酮碘溶液：1 ml : 0.01 g。

(其他见16.3.2)

西吡氯铵溶液[保(乙)]

Cetylpyridinium Chloride Solution

【适应证】用于口腔疾病的辅助治疗，也可用于口腔日常护理及清洁口腔。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 本品仅供含漱用，含漱后吐出，不得咽下。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】尚不明确。

【用法与用量】含漱：刷牙前后或需要使用时，一次15 ml，强力漱口1分钟，一日至少使用2次。

【制剂与规格】西吡氯铵溶液：200 ml : 0.2 g。

复方硼砂溶液[保(甲)]

Compound Borax Solution

【适应证】用于口腔炎、咽炎等口腔消毒防腐。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 含漱后应吐出，不可咽下。(3) 小儿、老年人、孕妇及哺乳期妇女慎用。(4) 本品误服后可引起局部组织腐蚀、吸收后可发生急性中毒，早期症状为呕吐、腹泻、皮疹以及中枢神经系统先兴奋后抑制等症状。一旦发生立即就医。(5) 用时应避免接触眼睛。

【禁忌证】(1) 新生儿、婴儿。(2) 对本品过敏者。

【不良反应】外用一般毒性不大，用于大面积损伤，其中的硼砂吸收后可发生急性中毒，早期症状为呕吐、腹泻、皮疹、中枢神经系统先兴奋后抑制。硼砂排泄缓慢，反复应用可产生蓄积，导致慢性中毒，表现为厌食、乏力、精神错乱、皮炎、秃发和月经紊乱。

【用法与用量】含漱：一次约10 ml，加5倍量的温开水稀释后含漱，一次含漱5分钟后吐出，一日3～4次。

【制剂与规格】复方硼砂溶液：每100 ml含硼砂1.5 g、碳酸氢钠1.5 g、液化酚0.3 ml、甘油3.5 ml。

甲紫溶液[保(乙)]

Methylrosaniline Chloride Solution

【适应证】用于皮肤和黏膜的化脓性感染、念珠菌引起的口腔炎，也用于烫伤、烧伤等。

【注意事项】(1) 面部有溃疡型损害时慎用，应避免造成皮肤着色。(2) 治疗鹅口疮时，只在患处涂药，如将溶液咽下可造成食管炎、喉头炎。(3) 涂药后不宜密封包扎。(4) 大面积破损皮肤不宜使用。(5) 不宜长期应用。

【禁忌证】哺乳期妇女乳房部位用药需防止婴儿经口吸入。

【不良反应】对黏膜可能有刺激或引起接触性皮炎。

【用法与用量】外用：取适量涂布患处，一日2～3次。

【制剂与规格】甲紫溶液：1%。

(其他见16.3.2)

碘甘油

Iodine Glycerin

【适应证】用于口腔黏膜溃疡、牙龈炎、冠周炎及慢性咽炎。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 新生儿慎用。(3) 仅供口腔局部使用。如误服中毒，应立即用淀粉糊或米汤灌胃，并送医院救治。(4) 涂布部位如有灼烧感、瘙痒、红肿等情况，应停止用药，并将局部药物洗净，必要时向医师咨询。

【禁忌证】对本品或其他含碘制剂过敏者。

【不良反应】偶见过敏反应和皮炎。

【用法与用量】外用：用棉签蘸取少量本品涂于患处，一日2～4次。

【制剂与规格】碘甘油：① 1%；② 2%。

15.4.1.2 软膏剂、糊剂、乳膏

制霉菌素（制霉素）[保(甲)]

Nystatin

【适应证】用于治疗下列疾病：(1) 口腔念珠菌病，还可将本品涂敷于义齿黏膜面，然后再戴上义齿。(2) 久治难愈的口腔黏膜病损如天疱疮、糜烂型口腔扁平苔藓等，配合糖皮质激素局部制剂。

【注意事项】(1) 对全身真菌感染无治疗作用。(2) 孕妇及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】口服较大剂量时可发生腹泻、恶心、呕吐和上腹疼痛等消化道反应，减量或停药后症状迅速消失。

【用法与用量】(1) 糊剂：外用，取适量局部涂布，每 2 ~ 3 小时一次，涂布后可咽下。(2) 片剂：口含，一次 1 ~ 2 片，一日 3 次。

【制剂与规格】制霉菌素片：50 万 U。

制霉菌素软膏：① 1g：10 万 U；② 1g：20 万 U。

(其他见 16.2.3.4)

复方甘菊利多卡因凝胶

Compound Chamomile and Lidocaine Hydrochloride Gel

【适应证】(1) 用于牙龈、唇及口腔黏膜的炎症性疼痛。(2) 缓解乳牙和智齿萌出过程中所出现的局部症状及由于使用正畸矫治器所致的局部症状等。(3) 作为佩戴义齿后所出现的疼痛不适及刺激性和(或) 过敏性反应的辅助性治疗。

【注意事项】请将本品置于儿童不可触及处。

【禁忌证】对本品中的各种成分已知有过敏反应的患者。

【不良反应】利多卡因可触发迟发变态反应和速发变态反应，可与其他酰胺类药物发生交叉过敏反应；频繁地局部使用利多卡因，特别是用于黏膜，可触发变态反应。

【用法与用量】(1) 牙龈或口腔黏膜炎症性疼痛：每次涂约 0.5 cm 凝胶于疼痛或发生炎症的牙龈区，稍加按摩，一日 3 次。(2) 治疗与使用义齿有关的症状或病损：可用约豌豆大小的凝胶，涂抹患处。

【制剂与规格】复方甘菊利多卡因凝胶：每克含盐酸利多卡因 20 mg、麝香草酚 1 mg、洋甘菊花酊 200 mg。

阿昔洛韦乳膏[基(基)，保(甲)]

Aciclovir Cream

【适应证】用于单纯疱疹或带状疱疹感染。

【注意事项】(1) 过敏体质者、孕妇、哺乳期妇女慎用。(2) 本品仅用于皮肤黏膜，不能用于眼部。(3) 涂药时应戴指套或手套。(4) 连续使用 7 日，症状未缓解，请咨询医师。(5) 用药部位如有灼烧感、瘙痒、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净；必要时向医师咨询。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】可见轻度疼痛、灼痛、刺痛、瘙痒及皮疹等。

【用法与用量】外用：涂于患处；成人与小儿均为白天每 2 小时 1 次，一日 6 次，共 7 日。

【制剂与规格】阿昔洛韦乳膏：3%。

(其他见 9.6.3)

盐酸米诺环素软膏

Minocycline Hydrochloride Ointment

【适应证】用于辅助治疗牙周炎、牙周脓肿、冠周炎等。

【注意事项】(1) 过敏反应，必须注意观察，一旦出现过敏征兆（瘙痒、发红、肿胀、丘疹、水疱等）立即停止用药。(2) 肝功能障碍以及严重肾功能低下的老年患者慎用。(3) 注药时患部可能出现一时刺激或疼痛，缓慢注药可明显减轻此症状。(4) 用药前去除软垢、龈上菌斑及牙石。(5) 注药后不得立即漱口及进食。(6) 局部如出现耐药性或不敏感菌所致的感染症应停止用药。

【禁忌证】对四环素类抗生素有过敏史的患者。

【不良反应】牙周袋内注射后即刻出现局部刺激，但随即消失，属于一过性反应。

【用法与用量】外用：在进行牙周冲

洗或牙周基础治疗后，通过纤细的特制注射器将软膏注入牙周袋深部，一周 1 次，连续用 4 次。

【制剂与规格】盐酸米诺环素软膏：0.5 g : 10 mg。

丁硼乳膏

Oilof Ocimum and Borax Cream

【适应证】适用于急、慢性牙龈炎、口腔炎等引起的牙痛、牙龈出血、肿痛、溃疡、溢脓等症状。

【注意事项】坏死性牙龈炎或急性牙龈炎患者不宜采用刷牙方法，可将乳膏涂搽患处。

【禁忌证】对硼砂、丁香油及丁香酚过敏者。

【不良反应】偶见过敏反应。

【用法与用量】外用：取适量乳膏涂于患处，一日 3 ~ 4 次。在患处滞留 3 ~ 5 分钟后用清水漱口洗去。也可将乳膏挤于牙刷上刷牙。睡前使用效果较好。

【制剂与规格】丁硼乳膏：含丁香油、硼砂等。

15.4.1.3 口含片

西地碘

Cydiodine

【适应证】用于慢性咽喉炎、口腔黏膜溃疡、慢性牙龈炎、牙周炎。

【注意事项】(1) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(2) 甲状腺疾病患者慎用。(3) 儿童请在医师指导下使用。(4) 连续使用 5 日症状未见缓解应停药就医。(5) 如服用过量或出现严重不良反应，应立即就医。

【禁忌证】对本品过敏者或对其他碘制剂过敏者。

【不良反应】(1) 偶见皮疹、皮肤瘙痒等过敏反应。(2) 长期含服可导致舌苔染色，停药后可消失。

【用法与用量】含服：一次 1 片，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】西地碘含片：1.5 mg (以碘计)。

地喹氯铵

Dequalinium Chloride

【适应证】用于急、慢性咽喉炎，口腔黏膜溃疡、牙龈炎。

【注意事项】(1) 过敏体质者慎用。(2) 本品应逐渐含化，勿嚼碎口服。(3) 如服用过量或出现严重不良反应，应立即就医。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】罕见皮疹等过敏反应；偶见恶心、胃部不适。

【用法与用量】含服：一次 1 ~ 2 片，每 2 ~ 3 小时 1 次，必要时可重复用药。

【制剂与规格】地喹氯铵含片：0.25 mg。

溶菌酶　用于急慢性咽喉炎，口腔黏膜溃疡及咳痰困难。含服：一次 1 片，一日 4~6 次。(其他见 14.3.2)

15.4.1.4 膜剂

膜剂的特点是经涎液浸泡后能成为溶胶，较牢固地黏附于口腔黏膜表面；膜剂内的药物缓慢释放出来，较长时间的作用于病损局部。

复方庆大霉素口腔药膜

Compound Gentamycin Oral Pellicles

【适应证】适用于复发性口疮、创伤性口腔溃疡、疱疮引起的溃疡等疾病。还可用于皮肤创伤及皮肤溃疡。

【注意事项】(1) 过敏体质者、运动员慎用。(2) 药膜敷贴后，舌尖或口腔黏膜有轻微麻木感觉是药物正常作用，作用过后即消失。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】尚未见有关不良反应报道。

【用法与用量】外用：取略大于溃疡面药膜贴于患处，一日 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】复方庆大霉素口腔药膜：内含硫酸庆大霉素 500 U、盐酸丁卡因 2 mg、醋酸地塞米松 60 μg。

利福平口腔药膜

Rifampicin Oral Pellicles

【适应证】用于口腔结核性溃疡。

【注意事项】药膜敷贴后，舌尖或口腔黏膜有轻微麻木感是药物正常作用，作用过后即消失。

【禁忌证】对本品中各种已知成分过敏者。

【不良反应】偶见有荨麻疹、肿胀和水肿等。

【用法与用量】外用：取与患处大小相应的薄膜，贴敷患处，一日 3 次。

【制剂与规格】利福平口腔药膜：主要含利福平、达克罗宁、泼尼松、甘油等。

(其他见 9.3.9)

15.4.2 口腔常用的局部麻醉药品

普鲁卡因[基(基)，保(甲)] 本品用于局部浸润麻醉、神经阻滞麻醉。用法：①浸润麻醉：0.25%～0.5% 溶液，每小时不得超过 1.5g；②阻滞麻醉：1% ～ 2% 溶液，每小时不得超过 1.0 g。(其他见 17.3)

利多卡因[基(基)，保(甲/乙)] 主要用于浸润麻醉、表面麻醉（包括在胸腔镜检查或腹腔手术时做黏膜麻醉用）及神经阻滞麻醉。用法：①表面麻醉：用 2% ～ 4% 溶液，每次量宜＜ 100 mg。②浸润麻醉或静脉注射区域阻滞：用 0.25% ～ 0.5% 溶液，50 ～ 300 mg。(其他见 17.3)

丁卡因[保(甲/乙)] 本品主要用于黏膜表面麻醉，0.1%～0.3% 溶液用于神经传导阻滞。用法：黏膜表面麻醉常用浓度 1%～2%，每次限量 40 mg。(其他见 17.3)

甲哌卡因

Mepivacaine

【适应证】用于口腔及牙科治疗中的局部浸润麻醉（神经传导阻滞型）。

【注意事项】(1) 使用前必须了解患者病情，身体现况及药物过敏史。(2) 避免对患者已受感染或红肿的部位进行麻醉。(3) 注射过程要缓慢，不间断，注射前回抽以确保针头不在血管内。(4) 每次进行麻醉时必须准备好镇静药（苯二氮䓬类安定药巴比妥酸盐）。(5) 患者在感觉恢复前不能咀嚼口香糖，也不能进食。(6) 运动员慎用。

【禁忌证】(1) 3 岁以下儿童。(2) 严重心血管疾病（如心肌梗死）患者或心律失常者。(3) 对氨基类麻醉药过敏者。(4) 严重肝病和肾病患者。

【不良反应】与其他氨基类局部麻醉药类似，不良反应可能由于以下原因引起过量注射、快速吸收或不小心注射入血管引起的血浓度升高，或者源于部分患者的过敏体质或者对药品耐受性差。

【用法与用量】用于口腔浸润及传导麻醉：3% 盐酸甲哌卡因注射液每支 1.8 ml，成人一次性使用不超过 3 支；对同一患者，使用频率不要高于每周 1 次。儿童每千克体重 0.025 ml，但一次不能超过 1 支。

【制剂与规格】甲哌卡因注射液：1.8 ml ∶ 54 mg。

复方甲哌卡因注射液：每 1.8 ml 含盐酸甲哌卡因 36 mg、肾上腺素 0.018 mg。

阿替卡因

Articaine

【适应证】口腔用局部麻醉药，特别适用于涉及切骨术及黏膜切开的外科手术过程。

【注意事项】(1) 应先行注射 5%～10% 的剂量试验是否存在过敏反应。(2) 缓慢注射，严禁注射于血管中，注射前必须做抽回血检查。(3) 使用过程中应维持与患者的语言交流。(4) 接受抗凝药治疗者须严密监视（监测国际标准化比值)。(5) 麻醉咬合危险：各种咬合（唇、颊、黏膜、舌)，建议患者在感觉恢复前不要咀嚼口香糖或食物。(6) 避免注射于感染及炎症部位（麻醉效果降低)。(7) 因酰胺类局麻药主要由肝脏代谢，严重肝功能不全患者需降低剂量。缺氧、高钾血症、代谢性酸中毒患者亦需降低使用剂量。(8) 高血压或糖尿病患者慎用。(9) 运动员慎用。

【禁忌证】(1) 对局麻药或本品其他成分过敏者。(2) 4 岁以下儿童。(3) 严重房室传导障碍而无起搏器的患者。(4) 经

治疗未得到控制的癫痫患者。(5) 卟啉病。

【不良反应】类似其他口腔用麻醉药，用药过量或某些以前用过该药的患者可能出现以下临床症状。(1) 中枢神经系统：神经质、易激惹、呵欠、震颤、恐惧、眼球震颤、多语症、头痛、恶心、耳鸣等。如出现以上症状，应注意患者呼吸状况，严密监视以防中枢神经抑制造成病情恶化或伴发癫痫。(2) 呼吸系统：呼吸过快，然后呼吸过缓，可能导致呼吸暂停。(3) 心血管系统：心动过速、心动过缓、心血管抑制伴随动脉低血压（可能导致虚脱）、心律失常（室性期前收缩、心室颤动）、传导阻滞（房室阻滞）等，以上心脏症状可能导致心脏停搏。(4) 本品中含有的抗氧剂亚硫酸盐可能引起过敏反应，如支气管痉挛等。

【用法与用量】4% 注射液每次注射量 0.8 ~ 1.7 ml，注射速度每分钟 1.7 ml；成人最大用量不超过 7 mg/kg，儿童最大用量不超过 5 mg/kg。

【制剂与规格】复方阿替卡因注射液：1.7 ml : 68 mg（含肾上腺素 1 : 100 000）。

15.5 口腔科治疗中常见的医学紧急情况和医学问题及其处理原则

进行口腔科治疗的患者可能也遭受不相关的医学状态。如果患者有全身疾病或正在服用其他药物，需要与患者的医生或会诊医生讨论。

15.5.1 肾上腺皮质功能不全

氢化可的松长期给药后突然停药可能会产生肾上腺皮质功能不全（adrenal insufficiency）。肾上腺皮质功能不全的患者在口腔科治疗时可能会产生低血压。

处理：将患者放平、吸氧、迅速请内科医生会诊或送往综合性医院治疗。

15.5.2 过敏反应

有过敏史或遗传性过敏反应史（哮喘、湿疹、花粉症等）的患者特别危险。治疗过程中，如果出现过敏反应（hypersensitivity），处理原则为：①患者平卧位，松开衣服。②保持呼吸通畅，仰头抬颏。③吸氧，喉头水肿要做气管切开。④测量、记录血压，脉搏。

治疗用药：轻者给予脱敏药物如钙剂、异丙嗪、糖皮质激素肌内注射或静脉注射及吸氧；严重过敏反应立即注射肾上腺素，给氧；出现抽搐或惊厥时迅速静脉注射地西泮 10 ~ 20 mg，或分次静脉注射 2.5% 硫喷妥钠，每次 3 ~ 5 ml，直到惊厥停止；如呼吸心搏停止，则按心肺复苏方法迅速抢救。

15.5.3 低血糖

胰岛素治疗的糖尿病患者在局部麻醉下进行口腔科治疗时，应注射胰岛素，并按时吃饭。如果未按时吃饭，血糖可能会低于正常值（低血糖，hypoglycemia）。出现颤抖、虚汗、口唇麻木、饥饿感、心悸、头痛（有时）、复视、注意力不集中、言语困难、意识混乱、行为改变、粗暴、痉挛、神志丧失等症状。儿童可无上述症状，但是可能会昏睡。

处理原则：①清醒的低血糖患者可给予 2 ~ 3 块糖果、4 ~ 5 块饼干或半杯含糖饮料，大多数患者在数分钟内缓解。如果 15 分钟仍未缓解，重复上法治疗一次。②疑似低血糖昏迷者，应立即抽血做有关检查，并马上供糖而不必等待检查结果，可采取下列措施，如立即静脉注射 50% 葡萄糖溶液 60 ~ 100 ml，多数患者能立即清醒，继而进食，未恢复者可反复注射直至清醒；血糖不能恢复或仍神志不清者必要时可选用：氢化可的松 100 mg 静脉注射后视病情需要再以 100 mg 加入 500 ml 葡萄糖溶液中缓慢滴注，一日总量在 200 ~ 400 mg；或以胰升糖素 0.5 ~ 1.0 mg 皮下、肌内或静脉注射，一般 20 分钟内生效，但维持时间仅 1 ~ 1.5 小时。

15.5.4 晕厥

大脑供血不足产生意识丧失。共同的原因是血管迷走神经性发作或由于情绪紧张导致的单纯的晕厥（syncope）。出现无力、低血压、苍白、出汗、打呵欠、脉率降低、恶心呕吐、瞳孔散大、肌肉颤动等症状。

处理原则：①立即停止口腔诊疗操作，迅速放平椅位，使患者头低位，下肢抬高以增加脑血液循环。②解开领口，保持呼吸道通畅，吸氧。③芳香氨酒精或氨水刺激呼吸，人中穴针刺。④低血糖者可口服或静脉注射高渗葡萄糖液，脉搏过缓者可静脉或肌内注射阿托品。

15.5.5 哮喘

在进行口腔科治疗时，哮喘（asthma）患者可能会哮喘发作。有严重急性哮喘的患者或进行口腔科治疗前哮喘加剧，须在进行口腔治疗前增加预防药物。要和患者的治疗医生讨论，其中包括增加吸入或口服皮质激素的剂量。

15.5.6 心脏突发事件

心脏突发事件(cardiac emergencies)：患者如有心绞痛史，很有可能携带硝酸甘油制剂，应允许患者使用。症状较轻者用患者自备药物治疗，不需住院治疗。心律失常可能也会导致突然的心排血量降低，产生意识丧失，必须采取治疗措施。

心绞痛处理原则：①就地休息尽量使患者减轻焦虑；立即服药。②其他见4.4.1。

急性心肌梗死处理原则：见4.12.1。

15.5.7 高血压

高血压（hypertension）患者很有可能正在服用降压药。在普通麻醉下，他们的血压可能降低，这很危险。此时应严密观察血压变化并减浅麻醉，准确估计可能的失血量和及时补充血容量。

15.5.8 血栓栓塞性疾病

血栓栓塞性疾病（thromboembolic disease）使用肝素或口服抗凝药的患者，可能在拔牙或其他口腔手术后发生过量出血。通常在完成抗凝治疗后再进行口腔科手术。

对于需要长期口服抗凝药的患者，应向内科医生咨询，最好在口腔科手术前，如果国际标准化比值（INR）值稳定，提前72小时，不超过24小时监测INR。进行非拔牙的小的口腔科手术的患者如INR值低于4.0（可能应为2.0）可继续华法林治疗，不必调整剂量。需拔牙的患者，如果INR值低于3.0（可能应为1.5），可继续华法林治疗，不必调整剂量。如果可能，应先进行单个摘除，如果效果较好，在后来的治疗中，再拔除其他的（同时拔2或3颗）。在手术过程中或手术后，应采取措施尽量减少出血。一些口腔科手术，通过齿槽缝合牙龈时，放止血药如胶原海绵或吸收性明胶海绵。

对于长期抗凝治疗的患者，在下列情况下，应求助于负责抗凝治疗的医生：INR值不稳定，如果INR值超过4.0或小的拔牙手术时INR值超过3.0；有血小板减少症、血友病或其他的止血功能紊乱，或肝损伤、酒精中毒或肾衰竭的患者；服用细胞毒性药物或接受放射疗法的患者。

接受抗凝治疗或凝血功能紊乱的患者不适于肌内注射；如果可能，含有收缩血管药的局部麻醉药应浸润注射或韧带内注射。如果必须采用局部神经阻断，局部麻醉药应用抽吸式注射器小心给药。

第16章 皮肤科疾病用药

本章包括下列常见疾病的药物治疗方案

- 皮肤及软组织细菌感染
- 皮肤真菌感染
- 病毒性皮肤病
- 疥疮
- 虱病
- 皮炎与湿疹
- 银屑病
- 痤疮
- 酒渣鼻
- 多汗症
- 白癜风
- 黄褐斑
- 梅毒

- 淋病
- 泌尿生殖道沙眼衣原体感染
- 尖锐湿疣
- 生殖器疱疹

16.1 皮肤病用药概论

皮肤病是机体对各种内外刺激的一种反应，主要有感染性皮肤病，包括病毒性、细菌性、真菌病等，性传播疾病属于感染性皮肤病；变态反应或免疫相关性皮肤病，包括皮炎、湿疹、特应性皮炎、银屑病、扁平苔藓、血管炎等；自身免疫性疾病，包括天疱疮、大疱性类天疱疮等获得性大疱性皮肤病及红斑狼疮、皮肌炎、硬皮病等结缔组织病；皮肤肿瘤，包括良性肿瘤（如脂溢性角化症、皮肤纤维瘤、汗管瘤、脂肪瘤等）、恶性肿瘤（如基底细胞瘤、鳞状细胞癌、恶性黑素瘤、皮肤T细胞淋巴瘤等）。还有代谢性皮肤病、遗传性皮肤病、物理性皮肤病、皮肤附属器疾病等，还有许多皮肤病病因不明，无法按病因分类，而是按形态学的改变来命名及分类，如红斑鳞屑性皮肤病、角化性皮肤病、色素性皮肤病等。

皮肤病病种繁多，病因复杂各异，因此治疗手段也是多种多样的，有药物治疗（包括内服及外用）、物理治疗（包括光疗、水疗、药浴、激光、冷冻等）、放射治疗、手术治疗、辅助治疗等。理想的治疗是去除病因，如脓疱疮、丹毒等感染性皮肤病，使用敏感的抗生素后可很快治愈；手足癣、体癣、股癣等浅表真菌感染以抗真菌药物外用即可；变态反应或免疫相关性皮肤病，有明确原因的如接触性皮炎，只要不再接触致敏物，再之适当处置，皮疹可以逐渐消退。但这一类中的许多病，如皮炎湿疹、银屑病、白癜风等，发病与免疫异常相关，确切病因却不清楚，只能针对发病机制中免疫或炎症的某些环节进行治疗或仅仅做对症治疗。皮肤种瘤一般采用手术切除；还有些皮肤病，如遗传性皮肤病、代谢性皮肤病等尚无有效的治疗手段。

本章主要讲述皮肤病的药物治疗，可分为系统用药及局部用药两大类。系统用药如抗生素、抗组胺药、免疫抑制药、糖皮质激素类等将在有关章节介绍。本章重点是皮肤病的外用药物治疗，写法上有的是以药带病，如皮肤科常用的抗感染药物、消毒防腐药及皮肤清洁剂、糖皮质激素制剂，有的是以病带药，如银屑病、皮炎湿疹、痤疮及酒渣鼻、白癜风及黄褐斑等。所选择的药物除了在我国批准上市（包括国产及进口）的，还结合我国的实际现状，选了一些医院制剂，供读者参考。辅助治疗，包括润肤剂、保湿剂等是皮肤病治疗或巩固疗效的一个重要手段，国外将其归入医学护肤品（cosmeceutical），这类制剂一般不含香料、防腐剂等易致敏的成分，一般在药店出售。我国对这类制剂并不作为药物，国产的制剂也不多，但鉴于它在皮肤科治疗上的重要性及今后的发展，本章将专门进行陈述。

外用药是皮肤病的一个主要治疗手段。根据皮肤病的病因、皮损特点，选择外用药物及其剂型是达到成功治疗的关键。

16.1.1 外用药物的剂型及其特点和选用

（1）外用药物的剂型及其特点

①散剂（粉剂，powder）：有干燥、保护、散热等作用，适用于无渗出的急性、亚急性皮炎。常用的有滑石粉、氧化锌粉等。

②溶液（solution）：是药物的水溶液，有清洁、散热、消炎及促进上皮新生的作用。可用作湿敷清洗用。适于有渗出的急性皮炎、湿疹或有小片糜烂、溃疡的皮肤损害。常用的有2%～4%硼酸溶液，0.05%小檗碱溶液，0.02%高锰酸钾溶液、0.1%依沙吖啶溶液等。

③酊剂和醑剂（tincture and spirit）：为药物的乙醇溶液或浸液。非挥发性药物的乙醇溶液为酊剂，如2.5%碘酊。挥发性药物的乙醇溶液为醑剂。酊剂或醑剂涂于皮肤后，乙醇挥发，溶于其中的药物均匀地分布在皮肤表面，发挥其药理作用。破损皮肤及口腔周围忌用。

④洗剂（lotion）：又称振荡剂（shake lotion），为不溶于水的粉剂（30%～50%）与水混合而成，用前应充分振荡混匀。有散热、干燥、消炎、止痒的作用。

适用于急性皮炎无渗出者。常用的有炉甘石洗剂等。

⑤软膏（ointment）：为药物与油脂性或水溶性基质混合制成的均匀的半固体外用制剂。油脂性基质常用凡士林及羊毛脂。软膏有保护、润滑、软化痂皮的作用。软膏的渗透作用较乳膏强，适用于慢性湿疹、神经性皮炎、银屑病等的治疗。有渗出的急性期皮损则不宜用软膏。

⑥乳膏（emulsion，cream）：指药物溶解或分散于乳状液型基质中形成的均匀的半固体外用制剂。由于基质不同，可分为水包油（oil in water，O/W）型和油包水（water in oil，W/O）型。乳膏的渗透性较好，又易于清洗，是目前最为常用的剂型。适于亚急性或慢性皮炎、湿疹等。

⑦糊膏（paste）：指大量的固体粉末（一般25%以上）均匀地分散在适宜的基质中所组成的半固体外用制剂。因含粉末量较大，有一定的吸收水分和收敛作用。适用于有轻度渗出的亚急性皮炎、湿疹。毛发部位不宜用糊膏。

⑧硬膏（emplastrum）：又称贴剂（adhesive plaster），药物溶于或混合于黏着性基质中并涂布在裱褙材料如纸、布或有孔塑料薄膜上而成。由于硬膏贴于皮肤表面后，阻止水分蒸发，增加了皮肤的水合作用，从而有利于药物的透皮吸收。适于慢性、限局性皮肤损害。有毛发部位不宜应用。

⑨油剂（oil）：是以植物油或矿物油类为溶剂或以不溶性粉末混于上述油类而制成的剂型。常用的有40%氧化锌油。适用于渗出不多的急性皮炎、湿疹，有清洁、保护、减轻炎症的作用。

⑩凝胶剂（gel）：指药物与能形成凝胶的辅料制成均一、混悬或乳状液型的稠厚液体或半固体制剂。局部涂后形成一层薄膜，清洁透明。

⑪涂膜剂（plastics）：指药物溶解或分散于含成膜材料溶剂中，涂搽患处后形成薄膜的外用液体制剂。

⑫搽剂（liniment）：指药物用乙醇、油或适宜的溶剂制成的溶液、乳状液或混悬液，供无破损皮肤揉擦用的液体制剂。

（2）外用药物剂型的选择：主要根据病期及皮损性质选择外用药物的剂型，见表16-1。

16.1.2 外用药物的经皮吸收

经皮吸收是决定外用药物临床疗效的一个关键因素。临床医师必须熟悉影响药物经皮吸收的因素，根据患者皮损的特点，选用适当的剂型和给药方式，提高治疗效果。对顽固难治或苔藓化肥厚性的损害可采用封包疗法。皮肤科常用的糖皮质激素制剂，应根据病变部位的不同而选择不同浓度不同强度的药物，对面部的损害应选择低浓度弱作用的如1%丁酸氢化可的松软膏，而对手掌足跖的损害应选择强效的制剂如0.05%倍他米松或氯倍他索软膏等。外用药物经皮吸收后亦可产生不利的一面。如长期局部外用糖皮质激素制剂，特别是高浓度、强作用的制剂后，可在用药局部皮肤出现毛细血管扩张、色素增加、萎缩和易发生感染等不良反应，有的药物如蒽林软膏、维A酸类制剂对皮肤有一定的刺激作用，外用后局部皮肤可潮红、脱屑。对少数过敏体质者，有的药物外用

表16-1 病期、皮损特点与外用药物剂型的对应表

病　期	皮损特点	剂　型
急性	红斑、丘疹、丘疱疹，无糜烂及渗出	粉剂、洗剂、溶液湿敷
	水疱、糜烂、渗出	溶液湿敷，油剂
亚急性	有少许渗出	糊膏、油剂
	无渗出	乳膏、软膏、凝胶剂
慢性	泛发慢性皮损	乳膏、软膏、酊剂
	限局性肥厚皮损	硬膏、软膏、乳膏、凝胶剂、涂膜剂
	单纯瘙痒而无原发皮损	酊剂、洗剂、乳膏、搽剂

可发生接触性皮炎。外用药物如果大面积使用，特别是用药浓度较高、使用面积较大、用药时间又长时，由于经皮吸收量大，药物可以进入血循环而产生全身性的不良反应，这种情况易出现在皮肤屏障功能较弱的婴幼儿或因皮炎湿疹等病变造成皮肤屏障功能受损的患者。

16.1.3 外用药物注意事项

（1）正确掌握使用方法。医护人员必须向患者详细说明药物的用法，如湿敷的方法；软膏、乳膏外用后应多加揉擦；对苔藓化肥厚皮损可采用封包疗法，以促进药物吸收，提高疗效。

（2）药物浓度要适当。有刺激性的药物应从低浓度开始逐渐递增，如维 A 酸类制剂，应从低浓度、小面积开始，逐步递增至高浓度、大范围。

（3）用药要考虑患者年龄、性别、皮损部位。如儿童不宜使用强作用的糖皮质激素制剂；皮肤皱褶及黏膜部位不应使用高浓度、有刺激作用的药物。

（4）应嘱咐患者，用药部位一旦出现刺激症状或红肿、皮肤瘙痒等过敏反应，应立即停药，清洗患处，并到医院就诊。

（5）适当的用量。乳膏及软膏在身体各部位外用，一日用药 2 次，1 周的最大用药量为面部 15 ~ 30 g、双手 25 ~ 50 g、头皮 50 ~ 100 g、四肢 100 ~ 200 g、躯干 400 g、腹股沟和外阴部 15 ~ 25 g。注意：这一推荐用量并不适用于糖皮质激素制剂，用量见糖皮质激素部分。

16.2 皮肤感染的药物治疗

16.2.1 皮肤细菌感染的药物治疗

皮肤及软组织细菌感染常见的病原菌是金黄色葡萄球菌及溶血性链球菌。皮肤感染较为浅表，常见的有脓疱疮、深脓疱疮即臁疮、毛囊炎、疖肿、皮肤外伤后感染等。软组织感染较为深在，常见的有蜂窝织炎、丹毒等。

16.2.1.1 脓疱疮的治疗

脓疱疮（impetigo）俗称“黄水疮”，是一种常见的化脓性皮肤病，主要由凝固酶阳性的金黄色葡萄球菌及（或）溶血性链球菌所致。临床表现包括 3 种主要类型：寻常型脓疱疮；大疱型脓疱疮和金黄色葡萄球菌烫伤样皮肤综合征（staphylococcal scalded skin syndrome，SSSS）。

脓疱疮的治疗原则为杀菌、消炎。①注意皮肤卫生，夏季勤洗澡。隔离患者，防止传染。增强营养，改善全身抵抗力。②局部治疗原则为清洁、消炎、杀菌、干燥、收敛。首选抗菌药物，如莫匹罗星软膏、夫西地酸软膏或鱼石脂软膏等。还可用甲紫溶液，一日用药 2 次。③局部用药前，可用 0.05% 小檗碱液或 0.02% 高锰酸钾液清洗患部。④皮损泛发，全身症状明显者，特别是 SSSS，应及时内用抗生素治疗。根据药敏试验选择抗生素，可选用头孢唑啉、氯唑西林等，也可选用其他二代或三代头孢类抗生素。

16.2.1.2 毛囊炎的治疗

毛囊炎（folliculitis）、疖（furuncle）和痈（carbuncle）是一组由细菌感染毛囊及其周围组织所致的炎症疾病。毛囊炎系单纯毛囊的感染；疖为毛囊和毛囊深部及周围组织的急性化脓性感染，如多个损害反复发生则为疖病（furunculosis）；痈系多个相邻毛囊的深部感染或由数个疖肿相互融合形成的皮肤深层脓皮病。致病菌主要为金黄色葡萄球菌。

治疗原则：多发毛囊炎应及早使用抗生素；对慢性反复发作病例，应寻找有无糖尿病、贫血等全身疾病；局部治疗以杀菌、清洁为原则，可配合紫外线、超短波等治疗。①局部治疗：外用药物常用莫匹罗星软膏、夫西地酸软膏、2.5% 碘酊或鱼石脂软膏等；物理治疗，早期可同时做超短波、远红外线、紫外线等理疗；手术治疗，晚期疖肿和痈应做切开引流。②全身治疗：适用于多发毛囊炎及疖肿、痈等，可选用耐青霉素酶的青霉素类或头孢菌素类。

16.2.1.3 丹毒的治疗

丹毒系溶血性链球菌（haemolytic streptococci）所致的皮肤、皮下组织内淋巴管及其周围组织的急性皮肤炎症。病

原菌主要为A族乙型溶血性链球菌，经过皮肤黏膜的微细损伤侵入，抠鼻、掏耳、足癣等常成为丹毒的诱因。蜂窝织炎(cellulitis)是由溶血性链球菌和金黄色葡萄球菌等引起的急性、亚急性或慢性的疏松结缔组织炎症。细菌通过皮肤小创伤而侵入，或者由淋巴和血行感染所致。

治疗原则为积极抗菌。早期、足量、有效的抗生素治疗可解除全身症状，控制炎症蔓延，防止复发。青霉素类可作为对溶血性链球菌所致感染的首选药物。其他病原菌可选用耐β内酰胺酶的青霉素类或头孢菌素类。

莫匹罗星[保(乙)]

Mupirocin

【适应证】革兰阳性球菌引起的皮肤感染，例如脓疱病、疖肿、毛囊炎等原发性皮肤感染及湿疹合并感染、溃疡合并感染、创伤合并感染等继发性皮肤感染。

【注意事项】基质内含有聚乙二醇，建议肾功能受损者慎用。本药不适用于假单胞菌属感染。妊娠期妇女慎用。仅供皮肤给药，勿用于眼、鼻、口等黏膜部位，误入眼内用水冲洗即可。

【禁忌证】对莫匹罗星或其他含聚乙二醇软膏过敏者禁用。

【不良反应】局部刺激反应，包括瘙痒、烧灼感等。

【用法与用量】外用：一日2～3次，一日最多使用3次，连续外用不应超过10日。

【制剂与规格】莫匹罗星软膏：2%，5g：100mg。

夫西地酸[保(乙)]

Fusidic Acid

【适应证】由葡萄球菌、链球菌、痤疮丙酸杆菌及其他对夫西地酸敏感细菌引起的皮肤感染，包括脓疱疮、疖、甲沟炎、创伤感染、须疮、汗腺炎、红癣、毛囊炎、寻常性痤疮的炎性损害。

【注意事项】避免接触眼部。不宜长时间、大面积使用。哺乳期妇女使用时，禁用于乳房部位的皮肤感染。

【禁忌证】对乳膏中的任何一种成分过敏者不能使用本品。

【不良反应】主要是用药局部皮肤反应，包括接触性皮炎、红斑、丘疹、瘙痒、皮肤过敏反应等。罕见有黄疸、紫癜、表皮坏死、血管水肿等。

【用法与用量】外用：一日2～3次，涂于患处，疗程为7日。

【制剂与规格】夫西地酸软膏：2% 5g：100mg。

(其他见9.3.15)

红霉素[基(基)，保(甲)]

Erythromycin

【适应证】脓疱疮等化脓性皮肤病、小面积烧伤、溃疡面的感染和寻常性痤疮的炎性损害。

【注意事项】避免接触眼睛及其他部位黏膜，如口、鼻等。妊娠期妇女与哺乳期妇女慎用。与氯霉素及林可霉素有拮抗作用，应避免合用。

【禁忌证】对大环内酯类过敏者。

【不良反应】偶见局部刺激症状和过敏反应。

【用法与用量】涂于患处：一日2次。

【制剂与规格】红霉素软膏：5g：50mg。

(其他见9.3.6)

新霉素[保(乙)]

Neomycin

【适应证】敏感细菌所致脓疱疮等化脓性皮肤病及烧伤、溃疡面的细菌性感染。

【注意事项】若大面积使用时需注意耳毒性及肾毒性，特别是在儿童、老人以及肾功能受损者。

【禁忌证】对新霉素或其他氨基糖苷类抗生素过敏的患者禁用。

【不良反应】变态反应性接触性皮炎，搽药局部潮红肿胀，皮疹，瘙痒。大面积外用吸收后可出现耳毒性及肾毒性。

【用法与用量】外用：一日2～4次，连续外用不应超过7日。

【制剂与规格】新霉素乳膏、软膏：含0.25%或0.5%。

复方新霉素软膏：每克含新霉素2000U、杆菌肽250U。

（其他见 9.3.4）

杆菌肽

Bacitracin

【适应证】用于葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎链球菌等敏感菌所致的皮肤软组织感染，仅局部应用。

【注意事项】避免接触眼睛及其他黏膜，如口、鼻。避免在创面长期和大面积使用，以免吸收产生肾毒性及耳毒性。连续使用不宜超过 1 周。儿童在成人监护下使用。避免与肾毒性及耳毒性药物合用。

【禁忌证】对本品有过敏反应史者禁用。

【不良反应】偶见皮肤瘙痒、皮疹、红肿或其他刺激现象，罕见局部过敏反应。

【用法与用量】涂于患处：一日 2～3 次，疗程 7 日。

【制剂与规格】杆菌肽软膏 8g：含杆菌肽 4 000 U。

多黏菌素[保（乙）]

Polymyxin

【适应证】细菌性皮肤感染。

【注意事项】若大面积使用时需注意肾毒性，特别是在儿童、老人以及肾功能受损者。

【禁忌证】对本药及基质过敏者，新生儿。

【不良反应】偶见过敏反应。

【用法与用量】外用：一日 2 次，若有需要可增加次数。

【制剂与规格】多黏菌素软膏：含多黏菌素 B 1 000 U，也用于复方制剂中。

复方多黏菌素 B 软膏[保（乙）]

Compound Polymyxin B Ointment

【适应证】脓疱疮等化脓性皮肤病，小面积外伤。擦伤与烫伤细菌感染的防治。

【注意事项】应避免在大面积烧伤面、肉芽组织或表皮脱落的巨大创面使用本品；使用时需注意肾毒性和耳毒性；儿童，妊娠及哺乳期妇女慎用；不适于眼内使用。

【禁忌证】对本品任一组分过敏者禁用。

【不良反应】偶见过敏反应、瘙痒、烧灼感、红肿等。

【用法与用量】局部用药：一日 2～4 次，疗程 5 日。

【制剂与规格】复方多黏菌素 B 软膏：每 10 g 中含硫酸多黏菌素 B 50 000 U、硫酸新霉素 35 000 U、杆菌肽 5 000 U 及盐酸利多卡因 400 mg。

环丙沙星[保（甲）]

Ciprofloxacin

【适应证】用于治疗脓疱疮、疖疮、毛囊炎、湿疹合并感染、外伤感染、癣病合并感染以及其他化脓性皮肤感染等。

【注意事项】使用中若出现过敏症状，应立即停用。不能大面积使用。妊娠及哺乳期妇女、儿童及老年人慎用。

【禁忌证】对本品及喹诺酮类药过敏的患者禁用。

【不良反应】偶有局部轻微刺痛感。

【用法与用量】涂患处：一日 2～3 次。

【制剂与规格】盐酸环丙沙星软膏：10 g : 30 mg。

盐酸环丙沙星乳膏：10 g : 30 mg。

盐酸环丙沙星凝胶：10 g : 30 mg。

（其他见 9.3.14）

磺胺嘧啶银[保（乙）]

Sulfadiazine Silver

【适应证】用于预防和治疗小面积、轻度烧烫伤所继发的创面感染。

【注意事项】对其他磺胺药或相似结构药物如磺酰脲类、砜类药物可有交叉过敏；缺乏葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶（G-6-PD）者慎用；老年患者、休克、失水、血卟啉症、AIDS 患者慎用；用药前应做肝、肾功能检查；长疗程用药者应定期检查血、尿常规。

【禁忌证】对磺胺类药及银盐过敏者；妊娠、哺乳期妇女；＜ 2 个月的婴儿；严重肝、肾功能不全者均禁用。

【不良反应】外用后有轻度刺激性，偶可有短暂性疼痛。药物经局部吸收后偶可发生磺胺嘧啶全身用药所致的各种不良反应，如过敏反应，出现皮疹、自觉瘙痒；长期使用时可有银中毒。

【用法与用量】外用。以乳膏或软膏

直接涂于创面，涂药厚度约为1.5 mm，或将软膏制成油纱布敷用，每1～2日换药1次，一日最多外涂30 g。

【制剂与规格】磺胺嘧啶银乳膏：含磺胺嘧啶银1%。

磺胺嘧啶银软膏：含磺胺嘧啶银1%。

磺胺嘧啶锌[保（乙）]

Sulfadiazine Zinc

【适应证】本品适用于预防及治疗2、3度烧伤继发创面感染，包括对该药呈现敏感的肠杆菌科细菌、铜绿假单胞菌、金黄色葡萄球菌、肠球菌属及念珠菌等真菌所致感染。

【注意事项】本品可自局部部分吸收，其注意事项同磺胺药全身应用。(1) 下列情况应慎用：缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶、血卟啉症、失水、休克和老年患者。(2) 交叉过敏反应。对一种磺胺药呈现过敏的患者对其他磺胺药亦可能过敏。(3) 对呋塞米、砜类、噻嗪类利尿药、磺脲类、碳酸酐抑制药呈现过敏的患者，对磺胺药亦可过敏。(4) 应用本品期间多饮水，保持高尿流量，以防结晶尿的发生，必要时亦可服药碱化尿液。(5) 治疗中须注意检查：①全血血常规，对接受较长疗程的患者尤为重要；②定期尿液检查以发现长疗程或高剂量治疗时可能发生的结晶尿；③肝、肾功能。

【禁忌证】(1) 对磺胺类药物过敏者。(2) 妊娠、哺乳期妇女。(3) 2个月以下婴儿。(4) 肝、肾功能不良者。

【不良反应】应用本品后部分病人可引起接触性皮炎。本品自局部吸收后偶可发生与磺胺药全身应用时相同的各种不良反应，包括：①过敏反应；②中性粒细胞减少或缺乏症、血小板减少症及再生障碍性贫血；③溶血性贫血及血红蛋白尿；④高胆红素血症和新生儿核黄疸；⑤肝、肾功能损害；⑥恶心、呕吐、食欲缺乏、腹泻、头痛、乏力等。

【用法与用量】用消毒溶液清洁创面后，将软膏或调成糊状的药粉直接涂于创面，然后用无菌纱布覆盖包扎；或将软膏或调成糊状的药粉涂于无菌纱布上，贴于创面，再覆盖无菌纱布包扎；也可直接将药粉撒布于创面上；或将涂有软膏的无菌纱布直接放入脓腔引流脓液，软膏用量随创面的大小及感染情况而定，一日用量不超过500 g（软膏）。

【制剂与规格】磺胺嘧啶锌软膏：10 g : 0.5 g。

磺胺嘧啶锌散：20 g。

复方磺胺嘧啶锌软膏：① 150 g ：磺胺嘧啶银1.5 g，磺胺嘧啶锌3 g。② 250 g ：磺胺嘧啶银2.5 g，磺胺嘧啶锌5.0 g；局部用于烧、烫伤所致的1、2度、深2度清洁创面及供皮区创面，有效预防及治疗创面继发感染。用法：(1) 直接、均匀、涂布与清洁创面，一日1次，一日用量不超过3 000 g。(2) 将本品均匀涂于皮肤创面，厚度0.15～0.3 mm，表皮完整的区域约10 分钟后成膜，无表皮创面30～120分钟后成膜。因运动致破损处仍可用本品补充完整。(3) 可用蒸馏水或无菌氯化钠溶液冲洗创面涂膜层。

甲硝唑[基（基），保（乙）]

Metronidazole

【适应证】用于炎症性丘疹、脓疱疮、酒渣鼻红斑的局部治疗。

【注意事项】用药后避免暴露于强烈的日光或紫外线下。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女；对本品或甲基咪唑类药物过敏者；有活动性中枢性疾病和血液病患者禁用。

【不良反应】对皮肤有轻度刺激性，如灼热、瘙痒感。

【用法与用量】外用：一日1～2次，薄薄涂一层于患处。

【制剂与规格】甲硝唑凝胶：①含甲硝唑0.75%；②含甲硝唑1.0%。

(其他见9.3.12)

鱼石脂[基（基），保（甲）]

Ichthammol

【适应证】用于疖肿。

【注意事项】不得用于皮肤溃烂处。避免接触眼睛和其他部位黏膜，如口、鼻等。连续使用一般不超过7日。用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药。对本品过敏者禁用，过敏体质者慎用。

【禁忌证】尚不明确。

【不良反应】偶见皮肤刺激和过敏反应。

【用法与用量】外用：一日 2 次，涂患处。

【制剂与规格】鱼石脂软膏：10% ~ 30%。

16.2.2 皮肤真菌感染的药物治疗

皮肤真菌感染可分为浅部及深部两大类。浅部真菌病主要包括皮肤癣菌病如手癣、足癣、体癣、股癣、甲癣及头癣等，还有念珠菌病和花斑糠疹等，临床很常见。深部真菌病主要是皮下真菌病如孢子丝菌病、着色芽生菌病等，较为少见。

绝大多数局限性浅表的真菌感染都可使用外用抗真菌制剂治疗。这类外用药物较多，常用的有咪唑类药物如咪康唑、联苯苄唑、益康唑、酮康唑和克霉唑等，丙烯胺类药如特比萘芬、萘替芬等，还有吗啉类药阿莫罗芬和环吡酮胺等。水杨酸、苯甲酸、十一烯酸、冰醋酸等兼有角质溶解和抑真菌作用，也常用于治疗皮肤真菌感染。剂型有乳膏、软膏、散剂、凝胶剂、溶液剂等（关于剂型的选择，参见表 16-1）。

为了防止复发，治疗在感染症状消失后需再维持 1 ~ 2 周。为了减轻炎症反应，抗真菌外用制剂可与糖皮质激素配合成复合制剂，如益康唑曲安奈德软膏复方酮康唑软膏等，由于并用的是中效至强效激素，因此此类复方制剂不能用于皮肤薄嫩处，更不能长期使用，以免产生皮肤萎缩等不良反应。对于顽固、泛发或有免疫功能缺陷的病例，可选用系统抗真菌药物治疗。如伊曲康唑一日 100 mg，连续 15 日，或一次 200 mg，一日 2 次，连续 7 日；也可用特比萘芬一日 250 mg，连续 1 ~ 2 周。

16.2.2.1 头癣的治疗

头癣（tinea capitis）是由皮肤癣菌感染头皮及毛发所致的疾病。根据致病菌种类和宿主反应性不同可分为黄癣、白癣、黑点癣以及脓癣。头癣应采取综合治疗，即口服药物、外用药物以及剃发消毒联合应用。各项措施需配合进行，不可偏废，以免造成治疗失败。

（1）口服药物：①灰黄霉素为首选药，儿童一日 15 ~ 20 mg/kg，口服，成人一日 0.6 ~ 0.8 g，分 3 次口服，连续服药 3 ~ 4 周。若对灰黄霉素过敏或治疗失败的病例，可采用伊曲康唑、特比萘芬或氟康唑口服。②伊曲康唑成人一日 100 ~ 200 mg，儿童一日 3 ~ 5 mg/kg，餐后立即服用，疗程 4 ~ 6 周。③特比萘芬成人一日 250 mg，儿童体重 < 20 kg 者，一日 62.5 mg，体重 20 ~ 40 kg，一日 125 mg，疗程 4 ~ 6 周。④脓癣治疗除内服抗真菌药物外，急性期可短期口服小剂量糖皮质激素，如有细菌感染需加用抗菌药，注意切忌切开引流。服药结束后进行真菌镜检，如病发的真菌镜检仍阳性，需延长疗程。以后每 10 ~ 14 日复查 1 次，连续 3 次阴性后方可认为治愈。

（2）外用：5% ~ 10% 硫黄软膏或其他抗真菌外用制剂，搽遍整个头皮，一日 2 次，连续 2 个月。

16.2.2.2 甲真菌病的治疗

甲真菌病（onychomycosis）是指由皮肤癣菌、酵母菌和其他真菌侵犯甲板所致的病变。其中由皮肤癣菌侵犯甲板所致的病变又称为甲癣（tinea unguium）。不同类型的甲真菌病治疗选择不同，包括外用药物、口服药物以及拔甲治疗等。

（1）口服药物治疗适用于各种类型的甲真菌病，无口服禁忌者，疗效肯定，安全性较好。一线药物推荐特比萘芬和伊曲康唑。①特比萘芬一日 250 mg，口服，指甲用药 8 ~ 10 周，趾甲用药 12 ~ 16 周。②伊曲康唑有两种用药方式。冲击疗法为每月第 1 周服药，一日 400 mg 分 2 次口服，后 3 周停药，为 1 个周期。指甲真菌病需口服 2 ~ 3 个周期。趾甲真菌病需 3 ~ 4 个周期。还可以一日服药 200 mg，连续 2 ~ 4 个月。③其他还可选用的药物包括氟康唑、酮康唑和灰黄霉素。但是，酮康唑和灰黄霉素肝毒性大，不推荐用于甲真菌病的治疗。

（2）外用药物适用于远端甲下型甲真菌病甲根部未受累的患者，或者口服禁忌患者，包括 5% 阿莫罗芬甲涂剂或 8% 环

吡酮甲涂剂等。外用抗真菌软膏由于药物不易透入甲板，不推荐使用。

(3) 对于病甲较厚，外用药物不易透入者，可以联合应用40%尿素霜封包或者外科拔甲等方法。

(4) 对于顽固性和复发性甲真菌病，推荐同时应用口服药物和外用药物联合治疗。

16.2.2.3 花斑糠疹的治疗

花斑糠疹（pityriasis versicolor），俗称“汗斑”，是由马拉色菌（Malassezia spp）累及皮肤角质层所致的慢性浅部真菌病，皮损表现为色素沉着或减退斑、表面覆盖有细小糠秕状鳞屑。治疗可用酮康唑洗剂、联苯苄唑洗剂、二硫化硒洗剂等。方法是洗浴时使药液在患处放置20～30分钟，隔日1次，连续2周。外用咪唑类药物如联苯苄唑、咪康唑、益康唑、克霉唑、酮康唑及丙烯胺类特比萘芬等也是可选择的药物。若外用疗法失败或感染广泛，则需要系统应用抗真菌药物治疗。伊曲康唑，一日200～400 mg，连续7～14日，治疗到真菌培养阴性为止，以后可改为1个月一次服200～400 mg伊曲康唑，也可氟康唑400 mg顿服。

16.2.2.4 皮肤念珠菌病的治疗

皮肤念珠菌病(cutaneous candidiasis)是由念珠菌属引起的，好发于身体潮湿的部位，如趾间、皮肤间擦部位、口角、外阴部等。可外用咪唑类抗真菌药物如联苯苄唑、咪康唑、益康唑、克霉唑、酮康唑治疗，也可外用特比萘芬。外用制霉菌素对念珠菌病同样有效。反复感染的念珠菌病需要系统治疗，通常使用三唑类抗真菌药如氟康唑、伊曲康唑等。

克霉唑[保（甲）]

Clotrimazole

【适应证】体癣、股癣、手癣、足癣、花斑癣、头癣，以及念珠菌性甲沟炎和念珠菌性外阴阴道炎。

【注意事项】妊娠及哺乳期妇女慎用。避免接触眼睛黏膜。过敏体质者慎用。

【禁忌证】对唑类药物过敏者禁用。

【不良反应】偶见局部刺激、瘙痒、烧灼感、接触性皮炎，皮肤可出现红斑、丘疹、水疱、脱屑等。偶见过敏反应。

【用法与用量】外用：一日2～3次。体股癣疗程一般需2～4周，手足癣需要4～6周。阴道念珠菌病用克霉唑阴道片，每晚1次，一次1片，10日为1个疗程。月经期停用。

【制剂与规格】克霉唑软膏：含克霉唑1%～3%。

克霉唑溶液：1.5%。

(其他见12.5.4)

益康唑[保（乙）]

Econazole

【适应证】浅部真菌病、花斑糠疹、念珠菌性口角炎。复方制剂适用于伴有真菌感染的皮炎、湿疹。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女慎用，尤其是妊娠初始3个月。不推荐用于儿童。(2) 治疗念珠菌病时避免局部紧密覆盖敷料。(3)本品仅作外用，避免接触眼睛黏膜。(4) 为避免复发，用于皮肤念珠菌病及各种癣症的疗程至少2周，足癣至少4周。

【不良反应】偶见局部刺激、瘙痒、烧灼感、接触性皮炎，皮肤可出现红斑、丘疹、水疱、脱屑等。偶见过敏反应。

【禁忌证】与其他含有可的松类制剂一样，复方制剂禁用于皮肤结核、梅毒、水痘或各种疱疹病毒感染。对本品过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日2次。

【制剂与规格】益康唑乳膏：1%。

复方硝酸益康唑乳膏：含1%硝酸益康唑，0.1%曲安奈德。

曲安奈德益康唑霜：15g：硝酸益康唑0.15 g，曲安奈德15 mg。用于手足癣、体癣、股癣、花斑癣和湿疹。局部外用。取适量涂于患处，一日早、晚各1次。治疗皮炎、湿疹时，疗程为2～4周。治疗炎症性真菌性疾病应持续至炎症反应消退，疗程不超过4周。

咪康唑[基（基），保（甲）]

Miconazole

【适应证】浅表真菌感染，皮肤念珠菌病，念珠菌性外阴阴道炎。

【注意事项】有心律失常者慎用。其他同克霉唑。

【禁忌证】对本药过敏者,妊娠期妇女,1岁以下儿童。

【不良反应】局部刺激症状如烧灼感、瘙痒等。

【用法与用量】外用：一日2次。花斑糠疹可一日1次。念珠菌性阴道炎用栓剂一次1片,一日1～2次,一个疗程7日。

【制剂与规格】咪康唑软膏：2%。

咪康唑阴道栓：100 mg。

酮康唑[保(乙)]

Ketoconazole

【适应证】手癣、足癣、体癣、股癣、花斑癣以及皮肤念珠菌病。

【注意事项】(1) 为减少复发，对体癣、股癣、花斑癣者，疗程至少2～4周。使用2～4周后，症状无改善或加重，应停药并咨询医师或药师。(2) 不得用于皮肤破溃处。避免接触眼睛和其他部位黏膜，如口、鼻等。(3) 用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药，并将局部洗净，必要时向医师咨询。(4) 儿童、妊娠及哺乳期妇女应在医师指导下使用。过敏体质者慎用。

【禁忌证】对酮康唑、咪唑类药物或亚硫酸盐过敏者禁用，对本品任何组分过敏者禁用。

【不良反应】局部使用本品治疗一般耐受性良好，罕见的不良反应有用药局部皮肤烧灼感、瘙痒、刺激、油腻或干燥。有报道对头发受到化学损伤或灰发的患者，使用本品后可能出现褪色。此外，偶见过敏反应。用药部位可能出现由刺激或过敏引起的接触性皮炎。

【用法与用量】(1) 乳膏：涂于患处，一日2～3次。(2) 洗剂：①花斑糠疹，一日1次，连续5日；②头皮脂溢性皮炎，一周2次，每两次之间至少相隔3日，连续4周，然后间歇性给药以控制症状的发作。

【制剂与规格】酮康唑片：200 mg。

酮康唑乳膏：2%。

酮康唑洗剂：① 2%；② 1%。

噻康唑

Tioconazole

【适应证】同克霉唑。

【注意事项】同克霉唑，妊娠初始3个月妇女避免使用。

【禁忌证】对本药或咪唑类抗真菌药过敏者禁用。

【不良反应】少数患者可出现皮肤局部刺激感、瘙痒等，极少数患者有过敏反应。

【用法与用量】(1) 噻康唑软膏：一日2～3次，涂于患处。(2) 28%噻康唑溶液：治疗甲真菌病，一日2次，疗程6～12个月。

【制剂与规格】噻康唑软膏：2%。

噻康唑乳膏：1%。

噻康唑溶液：28%。

联苯苄唑[保(乙)]

Bifonazole

【适应证】用于手癣、足癣、体癣、股癣、花斑癣及念珠性外阴阴道炎。

【注意事项】避免接触眼睛和其他部位黏膜，用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药；过敏体质者慎用。儿童须在成人监护下使用。

【禁忌证】对本品或咪唑类药物过敏患者禁用。

【不良反应】皮肤局部过敏、红斑、瘙痒感，偶可发生接触性皮炎。

【用法与用量】涂于患处：一日1次，并轻轻揉搓几分钟，2～4周为一疗程。

【制剂与规格】联苯苄唑乳膏：1%。

联苯苄唑溶液：1%。

联苯苄唑凝胶：1%。

舍他康唑

Sertaconazole

【适应证】由真菌、酵母菌、念珠菌、曲霉菌引起的皮肤感染，如体股癣、手足癣等。

【注意事项】同克霉唑。

【禁忌证】对硝酸舍他康唑或本品任何成分过敏者禁用。

【不良反应】局部刺激症状，如烧灼

感、瘙痒、红肿等。

【用法与用量】涂于患处：一日2次。

【制剂与规格】硝酸舍他康唑乳膏：2%。

萘替芬

Naftifine

【适应证】真菌性皮肤病，如手足癣、体股癣、头癣、皮肤念珠菌病等。

【注意事项】(1) 本药不能外用于眼、口腔或阴道等黏膜部位。本药仅供外用，切忌口服。(2) 妊娠及哺乳期妇女慎用，过敏体质者慎用。(3) 不宜用于急性炎症部位及开放性损伤部位。

【禁忌证】对萘替芬过敏者禁用。

【不良反应】有局部刺激，如红斑、烧灼、干燥、瘙痒等，个别患者可发生接触性皮炎。

【用法与用量】涂抹患处，皮损表面及四周约2.5 cm范围内的正常皮肤均应涂抹，一日1次。疗程一般2～4周，严重者可用至8周。

【制剂与规格】萘替芬软膏：1%。

萘替芬乳膏：1%。

萘替芬凝胶：1%。

萘替芬溶液：1%。

萘替芬散剂：1%。

萘替芬酮康唑乳膏(10 g)：盐酸萘替芬0.1 g、酮康唑25 mg。

特比萘芬[保(乙)] 用于手癣、足癣、体癣、股癣、花斑糠疹及皮肤念珠菌病等。外用：涂于患处，一日1次，1个疗程体股癣2～4周，手足癣、花斑糠疹4～6周。(其他见9.7.3.10)

布替萘芬[保(乙)]

Butenafine

【适应证】主要用于敏感真菌所致的手癣、足癣、体癣、股癣及花斑糠疹等。

【注意事项】本药不能局部用于口腔、眼或阴道内。对其他丙烯胺类药物过敏者慎用。其他同克霉唑。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见局部刺激、红斑、瘙痒、灼热感、刺痛、接触性皮炎等。

【用法与用量】涂抹患处：一日1次。

【制剂与规格】布替萘芬乳膏：1%。

布替萘芬溶液：1%。

利拉萘酯

Liranaftate

【适应证】手癣、足癣、体癣、股癣。

【注意事项】不能局部用于口腔或阴道内。禁用于角膜、结膜或糜烂部位。妊娠及哺乳期妇女、儿童及老年人慎用。

【禁忌证】对利拉萘酯及制剂所含其他成分有过敏史者禁用。对其他外用抗真菌药物有过敏史者禁用。临床上与皮肤念珠菌病、汗疱疹、掌跖脓疱病等炎症性皮肤病难以鉴别的患者禁用。

【不良反应】偶见接触性皮炎，局部瘙痒、发红、灼热感、刺痛等。

【用法与用量】涂于患处：一日1次并轻轻揉搓几分钟，2～4周为1个疗程。

【制剂与规格】利拉萘酯乳膏：2%。

阿莫罗芬[保(乙)]

Amorolfine

【适应证】皮肤真菌病，如手癣、足癣、股癣、体癣及甲癣；皮肤念珠菌病。

【注意事项】哺乳期妇女慎用。哺乳期妇女不应将本品用于胸部。在治疗期间应避免使用指甲油和人工指甲。避免接触眼睛黏膜。

【禁忌证】禁用于已知对本品过敏的患者。由于缺乏足够的临床试验数据，儿童(尤其是婴幼儿)应避免使用本品。由于缺乏足够的临床经验，本品不应大面积用于妊娠及哺乳期妇女炎症明显的皮肤，且不应用封包疗法。因为大量使用本品或在严重受损的皮肤处使用本品，无法排除机体对小量活性成分的吸收。

【不良反应】偶见局部刺激症状。

【用法与用量】(1) 阿莫罗芬乳膏：一日1次，晚上擦洗局部后使用，至少使用2～3周。若足部感染，需延长到6周，皮损恢复后需继续使用3～5日。(2) 甲搽剂：先热水浸泡，浸软甲板，然后锉甲，使其变薄，涂上一薄层药，一周1～2次，指甲需治疗6个月，趾甲需9～12个月。

【制剂与规格】阿莫罗芬乳膏：0.25%。

阿莫罗芬甲搽剂：5%。

环吡酮胺[保(乙)]

Ciclopirox Olamine

【适应证】浅部皮肤真菌感染，如体、股癣，手、足癣（尤其是角化增厚型），花斑癣，皮肤念珠菌病及甲癣。

【注意事项】应避免同时使用其他外用皮肤制剂，尤其禁止合用其他外用抗真菌药物。妊娠及哺乳期妇女慎用。不可用于眼睛黏膜。其他同克霉唑。

【禁忌证】儿童禁用。对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见局部发红、刺痛、瘙痒、烧灼感等刺激症状，偶见接触性皮炎。

【用法与用量】(1) 皮肤感染：涂于患处，一日2次，疗程2～4周。(2) 甲真菌病：初次使用8%环吡酮溶液之前，尽可能将被感染的指、趾甲剪去，并用指、趾甲锉将病甲磨粗糙。在治疗的第1个月内，隔日于病甲上涂药，第2个月可减少至一周至少用药2次，第3个月起一周用药1次。

【制剂与规格】环吡酮胺软膏：1%。

环吡酮溶液：8%。

制霉菌素（制霉素）[保(甲)]

Nystatin

【适应证】白色念珠菌、隐球菌和球孢子菌、滴虫的皮肤、口腔、阴道、消化道的感染。

【注意事项】妊娠及哺乳期妇女慎用，5岁以下儿童慎用。为防止复发，患者用药至症状消失48小时后。本药口服后胃肠道不吸收。

【禁忌证】对本品过敏的患者禁用。

【不良反应】外用偶见接触性皮炎。偶见局部发红、刺痛等刺激症状。阴道片或阴道栓可引起白带增多。

【用法与用量】(1)外用：一日2~3次。(2) 口腔感染：20万～40万U，口含，慢慢在口中溶解，一日4～5次。(3) 阴道感染：一日1个栓剂，连续使用2周。(4) 耳真菌病：用滴耳剂滴耳，一日2～3次。

【制剂与规格】制霉菌素软膏：1g : 10万U。

制霉菌素栓剂：10万U。

制霉菌素片：50万U。

制霉菌素滴耳液：10 mg : 5万U。

水杨酸[基(基)，保(甲)]

Salicylic Acid

【适应证】银屑病、皮肤浅部真菌病、脂溢性皮炎、痤疮、鸡眼、疣和胼胝等。

【注意事项】(1) 不能用于破溃的皮肤。避免接触口腔、眼睛以及黏膜。不宜长期、大面积使用，尤其是哺乳期妇女、儿童和老年人。5岁以下儿童不建议使用。慎用于皮肤皱褶部位。(2) 不同浓度药物的作用各不相同：1%～2%制剂有角质形成作用；5%～10%有角质溶解作用，抗真菌制剂一般在此浓度；20%～30%具有角质剥脱作用，可用于胼胝的治疗及明显角化过度性皮肤病；50%软膏具有腐蚀作用，可用于疣的治疗。(3) 本品忌与金属器皿接触。(4) 有糖尿病，四肢周围血管疾患者慎用高浓度软膏。(5) 勿与其他外用痤疮制剂或含有剥脱性作用的药物合用。

【禁忌证】对本品过敏反应者禁用。

【不良反应】有轻度刺激症状，偶可引起接触性皮炎。大面积使用吸收后可出现水杨酸全身中毒症状。

【用法与用量】外用：一日2次。

【制剂与规格】水杨酸软膏：① 2%；② 5%；③ 10%。

复方水杨酸溶液：每10 ml含水杨酸0.8 g、水杨酸甲酯0.2 ml、间苯二酚0.2 g。

苯甲酸[保(乙)]

Benzoic Acid

【适应证】手足癣、体股癣、头癣等浅部真菌感染。

【注意事项】外用本品局部可有轻微刺激，勿用于眼周及黏膜部位。本品的软膏剂和油膏不宜贮存于温度过高处。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】外涂可发生接触性皮炎。

【用法与用量】外用：一日2次。

【制剂与规格】苯甲酸软膏：6%。

复方苯甲酸软膏：含苯甲酸12%、水杨

酸 6%。

十一烯酸[保(乙)]

Unlecylenic Acid

【适应证】手癣、足癣、体癣及股癣。

【注意事项】有刺激性，勿使其进入体腔、眼部，严防内服。

【不良反应】少数患者可出现局部轻度烧灼感、瘙痒感等刺激症状。偶可引起接触性皮炎。

【禁忌证】(1) 局部严重溃烂者禁用。(2) 对本品过敏者禁用。

【用法与用量】外用于患处，一日 2 次，需连续应用数周。

【制剂与规格】复方十一烯酸锌软膏：① 含十一烯酸 5%、十一烯酸锌 20%；②含十一烯酸 3%、十一烯酸锌 20%；

复方十一烯酸锌撒布剂：含十一烯酸 2%、十一烯酸锌 20%、硼酸 1%。

复方土槿皮酊[保(乙)]

Compound Pseudolarice Tincture

【适应证】用于皮肤真菌感染、手足癣、体癣等。

【注意事项】有强烈刺激性，勿用于面部，勿使其进入体腔、眼部。严防内服。

【禁忌证】儿童、孕妇禁用。水疱型、糜烂型手、足癣禁用。

【不良反应】有轻度刺激症状，偶可引起接触性皮炎。

【用法与用量】外用：涂患处，一日 1 ~ 2 次，用药持续 1 ~ 2 周。

【制剂与规格】复方土槿皮酊：每 100 ml 含土槿皮 4.2 g、水杨酸 6.25 g、苯甲酸 12.5 g。

16.2.3 皮肤病毒感染的治疗

需以外用药物治疗为主的病毒性皮肤病主要是人乳头瘤病毒引起的各种疣，包括寻常疣、扁平疣及尖锐湿疣。人类疱疹病毒感染引起的单纯疱疹和带状疱疹外用药物可作辅助治疗。

16.2.3.1 单纯疱疹的治疗

单纯疱疹（herpes simplex）是由单纯疱疹病毒感染所致的病毒性皮肤病。皮疹以群集性小水疱为特征，好发于皮肤黏膜交界处，如口周、鼻腔、生殖器等处，自觉有灼热及痒感。发生在生殖器部位的疱疹称为生殖器疱疹。本病有自限性，但可复发。治疗原则为缩短病程，防止感染和并发症，防止复发。局部治疗可用 3% 阿昔洛韦软膏，1% 喷昔洛韦乳膏等。系统用抗病毒药物以核苷类为主。可用阿昔洛韦一次 0.2 ~ 0.4 g，一日 5 次或伐昔洛韦，一次 0.3 ~ 0.5 g，一日 2 次，或泛昔洛韦，一次 0.125 ~ 0.25 g，一日 3 次，疗程均为 7 ~ 10 日；频繁复发者，可用阿昔洛韦一次 0.4 g 或伐昔洛韦，一次 0.5 g，一日 1 次，或泛昔洛韦一次 0.25 g，一日 2 次，连续服用数月；重者可用阿昔洛韦一次 5 mg/kg，每 8 小时静脉注射 1 次。疱疹性口炎、眼炎，除选用上述方法外，尚应注意局部清洁杀菌，如用 0.1% 苯扎溴铵溶液漱口、0.1% 阿昔洛韦滴眼液等。

16.2.3.2 带状疱疹的治疗

带状疱疹（herpes zoster）系由水痘-带状疱疹病毒感染引起的一种以沿周围神经单侧分布的簇集性水疱及伴神经痛为特征的皮肤病。治疗以抗病毒、消炎、止痛，局部对症治疗和防止继发感染为原则。局部治疗以干燥、消炎为主。可外搽炉甘石洗剂，或阿昔洛韦软膏、喷昔洛韦乳膏。全身抗病毒药物可选用阿昔洛韦静脉滴注或口服，伐昔洛韦或泛昔洛韦口服，疗程 7 ~ 10 日。疼痛明显者可内服罗通定、布洛芬等。神经营养剂用维生素 B_1、维生素 B_{12} 等。皮损泛发严重者应加强支持疗法，防止并发细菌感染。

16.2.3.3 疣的治疗

疣(warts)是由人类乳头瘤病毒(HPV)感染引起的表皮赘生物。临床有寻常疣，扁平疣，跖疣及尖锐湿疣等。治疗应根据患者皮损的部位、数目、大小等选用相应的方法。局部治疗为，数目少的可选用电灼、冷冻、激光、刮除等；数目多的可选用外用药物。对数目多或久治不愈者还可选用全身用药，如聚肌胞注射液、干扰素等肌内或皮下注射，口服左旋咪唑等。尖锐湿疣及生殖器疱疹的治疗请参阅性传播

疾病部分。

阿昔洛韦[基(基), 保(甲)] 用于单纯疱疹、带状疱疹。5% 乳膏剂涂敷，白天每 3 小时 1 次，共 7 日。越早期治疗，效果越好。妊娠期妇女慎用。局部应用可见暂时性的刺痛或烧灼感；偶尔有红斑，瘙痒，皮肤发干。(其他见 9.6.3)。

喷昔洛韦[保(乙)]

Penciclovir

【适应证】口唇及面部单纯疱疹，生殖器疱疹。

【注意事项】慎用于儿童、老人、妊娠及哺乳期妇女。勿用于眼内及眼周。严重免疫功能缺陷患者应慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】暂时性的局部疼痛、灼热感、瘙痒。

【用法与用量】外用。白天每隔 3 小时给药 1 次，共 7 日。

【制剂与规格】喷昔洛韦乳膏：1%。

(其他见 9.6.3)

重组人干扰素 α-2b

Recombinant Human Interferon α-2b

【适应证】宫颈糜烂，尖锐湿疣，带状疱疹，口唇疱疹及生殖器疱疹。

【注意事项】疱疹病毒感染治疗开始越早效果越好。适于尖锐湿疣初期、数目少、疣体小的损害。对干扰素有过敏史者慎用。治疗宫颈糜烂，月经期间停止用药，治疗期间禁止性生活及坐浴。妊娠及哺乳期妇女和儿童慎用。

【不良反应】(1) 治疗病毒性皮肤病：暂时性的刺痛或烧灼感。(2) 治疗宫颈糜烂：轻度瘙痒，下腹部坠胀，分泌物增多。

【用法与用量】外用：涂于患处。①尖锐湿疣，一日 4 次，连续 6 ~ 8 周。②口唇疱疹或生殖器疱疹，一日 4 次，连续 7 日。③宫颈糜烂，隔日 1 次，6 ~ 10 次为 1 个疗程。

【制剂与规格】重组人干扰素 α-2b 乳膏或凝胶：① 5g : 25 万 U；② 5g : 100 万 U。

酞丁安 用于单纯疱疹、带状疱疹、尖锐湿疣、浅表真菌感染（如体癣、股癣、手癣、足癣等)。(其他见 9.6.3)

氟尿嘧啶[保(乙)]

Fluorouracil

【适应证】光线性角化症、Queyrat 红斑增殖病、鲍温样丘疹病、尖锐湿疣、寻常疣、扁平疣等。

【注意事项】面部损害涂药后可产生色素沉着。肝肾功能不良、感染、心脏病等患者慎用。不可用于黏膜。不可大面积使用。用药期间应定期检查血象。用药期间若出现毒性反应，应立即停药。皮肤破溃处不宜应用。

【禁忌证】孕妇及用药期间可能妊娠的妇女，对本品过敏的病人。

【不良反应】接触性皮炎、皮肤红肿、糜烂、炎症后色素沉着、疼痛、光敏、瘙痒等。

【用法与用量】外用：一日 1 ~ 2 次涂患处。

【制剂与规格】氟尿嘧啶凝胶：① 2.5%；② 5%。

氟尿嘧啶乳膏或软膏：① 2.5%；② 5%。

16.2.4 皮肤抗寄生虫感染的药物治疗

16.2.4.1 疥疮的治疗

疥疮 (scabies) 是由疥螨引起，主要通过直接接触传染，也可通过患者用过的衣物、床单等间接传染。在集体宿舍中可多人发病，在家庭中亦常数人患病。所以，若与患者密切接触者均需同时接受治疗，对患者用过的衣物、被褥等也均要消毒。患者衣服与被褥洗净后再用沸水或热水浸烫，或充分曝晒。

治疗主要用外用药，有 5% ~ 10% 硫黄软膏、γ-六氯化苯乳膏、10% ~ 25% 苯甲酸苄酯乳膏、10% 克罗米通乳膏等。药物需涂抹在全身，特别是皮肤皱褶部位，如手指间和足趾间，腋、腹股沟、阴肛部，女性乳下、男性阴囊及阴茎，还有远端甲下均需涂药。

有的患者在治疗后，虽然已无疥疮的特征性皮疹，亦不能再查到疥螨，但仍感瘙痒。此时可用 10% 克罗米通软膏或丁

香罗勒软膏外用，睡前可服有镇静作用的抗组胺药物。

16.2.4.2 虱病的治疗

虱病（pediculosis）包括头虱、体虱、阴虱。患者大多为卫生条件差、群居生活的人。通过直接接触患者或其衣物、被褥等而传染。

升华硫 [保（乙）]

Sublimed Sulfur

【适应证】用于疥疮、头癣、痤疮、脂溢性皮炎、酒渣鼻、单纯糠疹等。

【注意事项】家庭成员、集体宿舍成员中密切接触者均应同时接受治疗。长时间使用可引起皮肤瘙痒、刺激等不适。避免接触眼睛和其他黏膜。过敏体质者慎用。儿童慎用。不得与铜制品接触。

【禁忌证】对本药过敏者。

【不良反应】轻度刺激症状如灼热感、瘙痒等。

【用法与用量】外用：治疗疥疮时药物应涂抹在全身。①儿童，用5%硫黄软膏，早、晚各涂1次，连续3日，此期间不洗澡、不更衣，3日后洗澡、更衣。换下的衣服及床单等均应煮沸消毒。②成人，用10%硫黄软膏。早、晚各涂1次，连续3日，此期间不洗澡、不更衣，3天后洗澡、更衣。换下的衣服及床单等均应煮沸消毒。必要时，在停用3日后，可重复第2个疗程。

【制剂与规格】升华硫软膏：①5%；②10%。

林旦 [保（乙）]

Lindane

【适应证】用于疥疮和阴虱病。

【注意事项】家庭成员、集体宿舍成员中密切接触者均应同时接受治疗。过量使用可产生神经毒性、皮肤损害和营养不良，也会导致其不良反应增强。使用中若出现过敏症状或中枢神经系统产生不良反应，应立即停药。精神病患者尽量不用。药品不应与碱性物质或铁器接触。涂药前勿用热水和肥皂洗澡，以免增加吸收。避免眼和黏膜与药物接触。洗去药物时水温不要过热，以免促进药物吸收。4岁以上儿童应减量使用，老年患者慎用。本品吸收后是否经乳汁分泌缺乏临床资料，因此哺乳期妇女若使用本品，需停药4日后方可哺乳。

【禁忌证】对本品过敏者，有癫痫病史者和中枢神经系统器质性病变患者，婴幼儿、孕妇及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】轻度刺激症状如灼热感、瘙痒等，偶见荨麻疹。涂药后偶有头晕，1～2日后消失。长期大量使用后，可能由于药物经皮肤吸收后，对中枢神经系统产生毒性作用，如癫痫发作等。

【用法与用量】(1) 治疗疥疮：药物应涂抹在自颈部以下全身各部位，用药12小时后洗浴。换下的衣服及床单等均应煮沸消毒。儿童，应在6小时后洗浴，将药液彻底洗去；成人，一次用药量不超过30 g，儿童应减量使用。必要时1周后可重复治疗1次。(2) 治疗虱病：药物涂于干燥头发和头皮上，保留3～5分钟后清洗，24小时重复治疗。(3) 治疗阴虱病：应剃去阴毛后涂搽本药，一日3～5次

【制剂与规格】林旦乳膏：1%。

苯甲酸苄酯

Benzyl Benzoate

【适应证】疥疮，也用于体虱、头虱和阴虱。

【注意事项】同升华硫。不得用于破溃处；避免接触眼睛和其他黏膜。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女；12岁以下；癫痫患者。

【不良反应】轻度刺激症状，如灼热感、瘙痒，皮疹等。

【用法与用量】用法同升华硫。一日1～2次，应在用药24小时后洗去，共用2～3日。再用肥皂洗澡一次，并换用已消毒的衣被。

【制剂与规格】苯甲酸苄酯洗剂或搽剂：20%～25%。

苯甲酸苄酯乳膏：50%。

克罗米通 [保（乙）]

Crotamiton

【适应证】疥疮、皮肤瘙痒。

【注意事项】不能大面积用于婴儿及

低龄儿童的皮肤；避免接触眼睛及其他黏膜如口、鼻部位黏膜。

【禁忌证】对本药过敏者禁用；急性渗出性皮肤病禁用。

【不良反应】接触性皮炎，偶见过敏反应。

【用法与用量】(1) 用于疥疮时：治疗前洗澡、擦干，将本品自颈以下涂搽全身皮肤，特别是皱褶处、手足、指趾间、腋下和腹股沟；24 小时后涂第 2 次，再隔 48 小时后洗澡将药物洗去，换上干净衣服，更换被褥等。1 周后可重复 1 次。(2) 用于止痒时：局部涂于患处，一日 3 次。

【制剂与规格】10% 克罗米通乳膏、洗剂：10g : 1g。

丁香罗勒油

Ocimum Oil

【适应证】疥疮。

【注意事项】避免接触眼睛和其他黏膜如口、鼻等部位。如发生过敏症状，应停药。儿童必须在成人监护下使用。药品性状发生改变时禁用。其他同升化硫。

【禁忌证】对本品过敏者及皮肤糜烂处禁用。

【不良反应】偶见过敏反应如皮疹、瘙痒等。

【用法与用量】用药前修剪指甲、温水洗澡，然后用乳膏自颈部以下涂遍全身，早、晚各 1 次，连续 2 日。停用 2 日，自第 5 日起，再重复上述治疗 2 日，并消毒衣服及被褥。未愈者可再重复上述治疗。

【制剂与规格】丁香罗勒油乳膏：① 35 g : 0.875 g；② 10 g : 0.25 g。

16.3 皮肤清洁药和消毒防腐药

皮肤清洁药和消毒防腐药 (skin cleansing, disinfectants and antiseptics) 仅供外用。清洁药具有清洁皮肤或毛发和除去皮损上异物的功能。消毒药能迅速杀灭病原微生物，但同时也能损伤机体组织，如甲醛。防腐药作用比较缓和，能抑制微生物的生长繁殖，对组织损害较轻，如乙醇。使用消毒防腐药后需冲洗干净。

16.3.1 皮肤清洁药

皮肤清洁药 (skin cleansing) 具有清洁皮肤或毛发和除去皮肤上异物的功能。常用的有皂类、油类和氯化钠注射液等。

(1) 皂类 (soaps)：是脂肪酸或油脂与无机碱或有机碱反应所产生的物质，pH 一般为 9 ~ 10。肥皂中含有表面活性物质，用温水和肥皂可对皮肤进行清洗，并可以除去皮损上的鳞屑、结痂和其他异物。高脂皂 (superfatted soaps) 中脂肪酸或油脂的含量较高，能防止对皮肤的过度脱脂，但是其除污作用却因此而降低。液体肥皂 (shampoo)，又称香波，常用作毛发清洗剂，如 2% 酮康唑香波。注意事项：碱性较大的肥皂对皮肤的脱脂作用较强，长期使用会使皮肤变得干燥、粗糙，这类肥皂不适于皮脂缺乏者，也不适于皮肤柔嫩的婴幼儿使用。中性或微酸性肥皂对皮肤的脱脂和刺激作用较小。不良反应为肥皂的碱性和所含的表面活性物质等可使皮肤产生原发刺激或变态反应性接触性皮炎。

(2) 油类 (oils)：包括矿物油类、植物油类和动物油类，常用的有花生油、橄榄油、液状石蜡等。单纯的油类物质可以清除皮损上的鳞屑、结痂和其他异物，它们对皮肤几乎没有刺激。油类物质除具有清洁皮肤的作用外，还可作为油剂、软膏剂和乳膏剂等剂型的基质成分。

(3) 溶液：氯化钠注射液是 0.9% 的氯化钠水溶液，可用于湿敷及冲洗皮损上的污物。

16.3.2 消毒防腐药

消毒防腐药是能杀灭病原微生物或抑制其生长繁殖的制剂。

消毒防腐药的作用机制可归纳为以下 3 类。第一，蛋白质变性作用，如酚类、醇类、醛类、酸类和重金属等，它们能够引起微生物原浆蛋白质凝固或变性，使其生长繁殖受到抑制而死亡。第二，干扰酶系统，如重金属盐类能与微生物的蛋白质巯基酶结合，使其活性降低或消失，从而影响其代谢；氧化剂类和卤素类也能氧化微生物体内某些酶系统；染料类的药物也

可能是通过干扰微生物的某些酶系统而影响其代谢过程。第三，增加胞浆膜通透性，胞浆膜通透性的增加，可以使细胞内营养物质外漏而导致病原微生物的死亡，达到杀菌目的。

高锰酸钾[保(乙)]

Potassium Permanganate

【适应证】用于创面、溃疡面或化脓性皮肤损害等的清洁、除臭及痔疮坐浴等。

【注意事项】本品有强氧化作用，具有强而快的杀菌作用，可除臭、消毒，但作用短暂、表浅。清洗创面，坐浴，对红皮病或大面积感染皮损者可供浸浴用。溶液应新鲜配制，久置或加温可迅速失效。勿用于黏膜部位。结晶不可直接与皮肤接触。

【不良反应】对皮肤及器皿有一定的染色作用。高浓度对皮肤有腐蚀和刺激作用。

【禁忌证】口服可致口腔黏膜腐蚀、水肿、胃肠道出血、肝肾功能损伤。高浓度的严禁口服。

【用法与用量】(1) 高锰酸钾水溶液：0.1% ~ 0.5%，用于清洗创面。(2) 高锰酸钾水溶液：0.02%，用于坐浴，浸浴、洗胃、阴道冲洗等。(3) 高锰酸钾水溶液：0.1%，用于水果及食具的消毒。

【制剂与规格】高锰酸钾：0.1 g。

过氧化氢溶液[保(乙)] 适用于清洗化脓性创面、皮肤溃疡等，尤其适用于厌氧菌感染及气性坏疽的创面。应用 3% 过氧化氢水溶液，用棉球蘸后清洗创面，也可冲洗或湿敷。对大面积皮肤或口腔黏膜损害如寻常型天疱疮或重症多形性红斑，可将 3% 过氧化氢、2% 普鲁卡因及 0.1% 依沙吖啶溶液等量混合后湿敷或漱口。(其他见 14.1.4)

硼酸[保(乙)]

Boric Acid

【适应证】用于急性或亚急性皮炎湿疹有糜烂、渗液处的冷湿敷；皮肤和黏膜损害的清洁。

【注意事项】外用制剂，不可内服。婴幼儿慎用。

【禁忌证】婴儿禁用。3 岁以下幼儿慎用。避免长期大面积外用，以免吸收中毒。

【不良反应】大量吸收引起的急性不良反应有消化道、神经系统、心血管和泌尿系统症状，严重者可致死。慢性中毒者可有乏力、厌食、脱发、月经紊乱及精神错乱等。

【用法与用量】冷湿敷：一日数次。

【制剂与规格】硼酸溶液：2% ~ 4%。

苯酚

Phenol

【适应证】用于皮肤轻度感染和止痒。有较强的杀菌作用，能杀灭大多数细菌，对芽胞和病毒无效。低浓度时具有局部止痛和止痒作用。

【不良反应】高浓度对组织有腐蚀性和刺激性。

【禁忌证】尿布皮炎患儿及 6 个月以下婴儿禁用。

【用法与用量】(1) 水溶液、乙醇溶液或软膏剂：0.5% ~ 2%，用于止痒、镇痛。(2) 乙醇溶液：5% ~ 10%，外搽手掌足跖用于手足多汗症的治疗，外搽于腋窝用于腋臭，以止汗除臭等。(3) 20% 以上的水溶液，用于急性女阴溃疡及软下疳等，杀菌并刺激上皮生长，促进溃疡愈合，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】苯酚溶液：≤ 2%。

苯酚软膏：2%。

乙醇

Alcohol

【适应证】外用消毒。常用作消毒防腐用，能使蛋白质变性而发挥杀菌作用，但对芽胞无效。

【不良反应】长期外用时由于乙醇具有去脂作用，可使皮肤变得干燥。

【用法与用量】75% 乙醇水溶液用于皮肤消毒。作为溶媒，加入其他药物配成酊剂，如 2% ~ 4% 红霉素乙醇用于痤疮的治疗。

【制剂与规格】稀乙醇：75%，100 ml：500 ml。

甲醛

Formaldehyde

【适应证】除消毒防腐作用外，还用作手足多汗症、腋臭、寻常疣、扁平疣等的治疗。水溶液对细菌、芽胞、真菌和病毒都有效，具有消毒、防腐、止汗和收敛作用。

【注意事项】勿接触眼、外阴及呼吸道黏膜。

【禁忌证】乙醇过敏者、孕妇禁用。

【用法与用量】一般制成40%水溶液，即福尔马林溶液。(1) 5%～10%福尔马林乙醇溶液或水溶液：用于手足多汗和腋臭等；也用作表面消毒。(2) 10%～20%福尔马林水溶液：用于寻常疣及扁平疣，将药液外搽于皮损上，一日2次，用于跖疣时可以药液浸泡患足，每晚1次，一次5～10分钟。

碘酊

Iodine Tincture

【适应证】用于一般皮肤消毒，也用于传染性软疣及头癣等的治疗。

【注意事项】碘对黏膜有刺激作用，因此不能用于黏膜部位。

【禁忌证】对碘过敏者忌用。

【用法与用量】碘酊配方为碘2.0，碘化钾1.5，乙醇50 ml，水加至100 ml。用于传染性软疣，应先以镊子夹去疣体，然后外搽碘酊。用于头癣治疗，患者应剃去头发，白天外用头癣软膏，晚上洗头后外搽碘酊。

【不良反应】碘对皮肤和黏膜有强烈的刺激作用，浓度过高可引起皮肤起疱及皮炎。外用也可引起刺激和灼烧。

【制剂与规格】碘酊：①含碘2%、碘化钾1.2%；②含碘3%、碘化钾1.8%。

聚维酮碘

Povidone Iodine

【适应证】皮肤消毒，外伤皮肤黏膜消毒，慢性咽喉炎，口腔溃疡等。

【注意事项】皮肤破损和肾功能不全时慎用。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女、对碘或聚维酮碘过敏者禁用。

【不良反应】偶见过敏；面积较大的伤口和严重烧伤皮肤大面积使用可引起全身不良反应，如代谢性酸中毒、高钠血症以及肾功能损伤。

【用法与用量】(1) 10%聚维酮碘乙醇溶液：用于小伤口及感染，一日2次。用于手术操作前后的皮肤消毒。(2) 10%聚维酮碘溶液：用于手术操作前后的皮肤消毒。(3)5%聚维酮碘溶于表面活性剂中：用于皮肤清洁。

【制剂与规格】聚维碘溶液：① 1%；② 2.5%；③ 5%；④ 7.5%；⑤ 10%。

聚维碘凝胶：① 0.5%；② 1%。

聚维碘乳膏：10%。

甲紫[保(乙)]

Methylrosaniline Chloride

【适应证】用于皮肤和黏膜的化脓性感染、白色念珠菌引起的口腔炎，也用于烫伤、烧伤等。

【注意事项】面部有溃疡性损害时应慎用，不然可造成皮肤着色；只能作短期外用，不能长期使用；大面积破损皮肤不宜使用。卟啉症患者慎用。

【不良反应】对黏膜可能有刺激或引起接触性皮炎。

【用法与用量】外用：①治疗黏膜感染，用1%水溶液外涂，一日2～3次；②用于烧伤、烫伤：用0.1%～1%的水溶液外涂。

【制剂与规格】甲紫溶液：1%。

甲紫糊剂：1%。

依沙吖啶[保(乙)]

Ethacridine

【适应证】适用于敏感革兰阳性菌及革兰阴性菌引起的浅表皮肤感染，如创伤性伤口感染、化脓性皮肤感染等。

【注意事项】(1) 用于湿敷的薄纱布或薄棉片剪成病损大小，在湿敷过程中，纱布或棉片要保持药液饱和状态。(2) 本品遇光色泽加深，不可再用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】有一定的致敏性，个别人可发生变态反应性接触性皮炎。

【用法与用量】(1) 0.1%～0.2%依

沙吖啶水溶液：做伤口或创面的清洗，湿敷用。(2) 复方依沙吖啶软膏、糊膏剂：用于化脓性皮肤病，外用前应首先清洗，然后以药膏外涂于患处，一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】乳酸依沙吖啶溶液：0.1%。

乳酸依沙吖啶软膏：1%。

苯扎溴铵

Benzalkonium Bromide

【适应证】本品为阳离子表面活性剂，具有清洁、杀菌和消毒作用，对多种革兰阳性菌和阴性菌、真菌和多种病毒均具有较强的杀灭作用。可用于皮肤、黏膜和小面积伤的消毒。

【注意事项】(1) 本品应避光长期反复应用，以防引起过敏反应。(2) 应用本品时应避免接触眼睛、脑、脑膜、中耳等部位。(3) 本品不宜用于膀胱镜、眼科器械及合成橡胶的消毒。(4) 勿与肥皂、盐类及其他合成洗涤剂同时使用，避免使用铝制容器、茶氯乙烯瓶盛放。(5) 对结核杆菌和铜绿假单胞菌无效。

【不良反应】口服可造成恶心、呕吐。浓溶液可致食管损伤或坏死。

【用法与用量】0.05% ~ 0.1% 水溶液，外搽或浸泡。复发性毛囊炎的好发部位可经常以此溶液涂搽。

【制剂与规格】苯扎溴铵溶液：5%。

氯己定 用于创伤、烧伤、皮肤疾病的消毒。0.05% 醋酸氯己定溶液或葡萄糖氯己定溶液，用于创伤、烧伤、皮肤疾病的消毒；0.02% 溶液作为膀胱灌注液，用于尿路感染；0.05% 水溶液用于冲洗创伤伤口。(其他见 15.4.1.1)

苯氧乙醇 Phenoxyethanol

【适应证】本品对铜绿假单胞菌有强抑菌作用，对变形杆菌和革兰阳性杆菌也有效，可用于铜绿假单胞菌感染的化脓性皮肤病。

【用法与用量】1% ~ 2% 苯氧乙醇水溶液或油剂，清洁后外用。

【制剂与规格】苯氧乙醇溶液：① 1%；② 2%。

16.4 外用糖皮质激素

16.4.1 分类

外用糖皮质激素具有抗炎、抗过敏、免疫抑制及抗增生等药理作用。根据外用糖皮质激素的药理作用强度可大致可分为弱效、中效、强效和超强效 4 类，但其浓度和基质成分的不同也可改变其作用强度。目前国内常用的外用糖皮质激素（表 16-2）。

表 16-2 国内常用的外用糖皮质激素

强度	药 物	制剂浓度 (%)
弱效	醋酸氢化可的松	1.0
中效	醋酸地塞米松	0.025 ~ 0.075
	丁酸氢化可的松	0.1
	醋酸曲安奈德	0.1
强效	糠酸莫米松	0.1
	二丙酸倍氯米松	0.025
	氟轻松	0.025
	哈西奈德	0.025
超强效	卤米松	0.05
	哈西奈德	0.1
	丙酸氯倍他索	0.02

制剂的剂型可以有软膏、乳膏、溶液或硬膏等

16.4.2 适应证

(1) 主要用于过敏性或与变态反应相关的非感染性炎症性皮肤病，包括皮炎和湿疹类如特应性皮炎、湿疹、接触性皮炎、光感性皮炎、虫咬皮炎等。

(2) 其他免疫性或与免疫相关性皮肤病，如盘状红斑狼疮、扁平苔藓、银屑病、白癜风等。

(3) 某些瘙痒性皮肤病，如神经性皮炎、阴肛部瘙痒症等。

16.4.3 药物和制剂的特点及其选择

外用糖皮质激素有消炎、止痒和抑制皮损发作的作用。不少皮肤病病因不明，病程迁延，常反复发作，如手部湿疹，在皮损消退后仍应每周间歇使用 1 ~ 2 次，做维持治疗，以巩固疗效，防止复发。对银屑病的治疗详见银屑病部分。

外用糖皮质激素的品种很多，它们作用的强弱和剂型不同，浓度也各异，要根据皮肤病的性质、皮损类型、部位、患者

年龄等因素选择用药。如面部、腹股沟、腋窝、外阴部等皮肤柔嫩及皱褶部位应使用弱效或中效制剂。慢性革化肥厚性皮损或手掌足跖部皮损需使用强效或超强效激素制剂，必要时需做封包治疗。婴儿或儿童皮肤薄嫩，易出现不良反应，通常用弱效或中效激素制剂且使用时间不宜过长。对特应性皮炎严重、肥厚的皮损可短期使用中、强效激素制剂 1 ~ 2 周，当皮损好转后换用稍弱的制剂。在特应性皮炎急性发作期，可短期使用强效制剂，尽快控制其症状。对合并有细菌或真菌感染的皮肤病变，应选择含有抗菌成分的外用复方激素制剂。

16.4.3.1 常用的糖皮质激素制剂

(1) 醋酸氢化可的松软膏：① 0.5%；② 1%；③ 2.5%。其中 0.5% 及 1% 的为弱效外用糖皮质激素制剂。长期外用于面部，可发生毛细血管扩张等不良反应。

(2) 醋酸地塞米松软膏或乳膏：0.05%，为中效外用糖皮质激素制剂。长期外用于面部，可发生毛细血管扩张、口周皮炎等不良反应。

(3) 复方地塞米松 (Compound Dexamethasone Acetate) 软膏：为中效糖皮质激素制剂。本品 20 g 含地塞米松 0.015 g、樟脑 0.2 g、薄荷脑 0.2 g，止痒效果强于单纯使用地塞米松制剂。

(4) 丁酸氢化可的松软膏：0.1%，为中效外用糖皮质激素制剂。适用于面部、皱褶部位及儿童，但不应长期、大面积使用。长期外用于面部，可发生毛细血管扩张等不良反应。

(5) 醋酸曲安奈德软膏或乳膏：0.1%，为中效外用糖皮质激素制剂。也有含有尿素的制剂曲安奈德尿素软膏，尿素可增加水合作用，从而促进药物的吸收。

(6) 糠酸莫米松 (Mometasone Furoate) 软膏或乳膏：0.1%，为中强效外用糖皮质激素制剂，可短期外用于面部、皮肤皱褶部位及儿童，时间不应超过 2 周。每日外用 1 次即可。

(7) 丙酸倍氯米松软膏：0.025%，为强效外用糖皮质激素制剂，主要用于较严重的湿疹、皮炎及银屑病等。

(8) 醋酸氟轻松软膏：① 0.025%；② 0.01%。本品为强效外用糖皮质激素制剂，主要用于较严重的湿疹、皮炎及银屑病等。

(9) 哈西奈德：①哈西奈德软膏或乳膏，0.025% 或 0.1%，为外用强效糖皮质激素制剂。②溶液剂，0.1%，为超强效激素制剂。主要用于革化肥厚、限局性的湿疹、皮炎及银屑病等。不应用于面部、儿童及皮肤皱褶部位。

地奈德[保(乙)]

Desonide

【适应证】用于对皮质激素治疗有效的各种皮肤病，如接触性皮炎、神经性皮炎、脂溢性皮炎、湿疹、银屑病、扁平苔藓、单纯性苔藓、汗疱症等引起的皮肤炎症和皮肤瘙痒的治疗。

【注意事项】(1) 本品需在医生指导下使用，仅供外用，避免接触眼睛。(2) 除患有适应证中疾病的患者外，其他皮肤病患者不宜使用本品。(3) 皮肤治疗区域的密闭性包扎、覆盖应在医生指导下进行。(4) 孕妇应充分权衡利弊后慎用本品。(5) 哺乳期妇女慎用。(6) 儿童外用此类药品时应在有效前提下选择最低的剂量，长期使用此类药品可导致儿童生长发育迟缓。

【禁忌证】对外用皮质激素或本品中含有的其他成分过敏者禁用。

【不良反应】局部使用偶可引起灼热、瘙痒、刺激、皮肤干燥、毛囊炎、多毛症、痤疮样皮疹、色素脱失、口周炎、继发感染以及皮肤萎缩等。

【用法与用量】均匀涂搽于患处，一日 2 ~ 4 次。银屑病及其他顽固性皮肤病可采用本品封包治疗，若发生感染则应结束封包，并使用适当抗菌药物治疗。

【制剂与规格】地奈德乳膏：15 g : 7.5 mg。

(10) 卤米松 (Halometasone Monohydrate) 软膏或乳膏：0.05%，为超强效糖皮质激素制剂。主要用于严重的顽固性湿疹、皮炎及银屑病等。不应用于面部、儿童及皮肤皱褶部位。

(11) 丙酸氯倍他索软膏：① 0.02%；

② 0.05%。本品为超强效糖皮质激素制剂。主要用于严重的顽固性湿疹、皮炎及斑块性银屑病等，短期使用。不应用于面部、儿童及皮肤皱褶部位。

16.4.3.2 含有抗菌药物的复方糖皮质激素制剂

（1）曲安奈德益康唑（Triamcinolone Acetonide and Econazole）软膏：为硝酸益康唑 1% 和曲安奈德 0.1% 的复方制剂。益康唑既有抗真菌，又有抗细菌作用，曲安奈德为中效糖皮质激素，该制剂主要用于对弱效糖皮质激素制剂治疗反应差的各种湿疹、皮炎及银屑病等，皮炎、湿疹合并轻度真菌和细菌感染者更为适用。

（2）复方曲安奈德软膏：每克含制霉菌素 10 万 U、硫酸新霉素 2.5 mg、短杆菌肽 0.25 mg、曲安奈德 1.0 mg，主要用于合并有轻度真菌、念珠菌和细菌感染的皮炎湿疹类皮肤病。

（3）卤米松三氯生乳膏：为超强效糖皮质激素复方制剂。每克含卤米松 0.5 mg，三氯生 10 mg。三氯生有广谱抗菌作用，抗菌谱包括革兰阳性细菌和革兰阴性细菌以及皮肤真菌，因此更适于合并轻度感染的慢性顽固性皮炎、湿疹类皮肤病。应短期应用。

（4）复方酮康唑软膏：为超强效糖皮质激素复方制剂，每克含丙酸氯倍他索 0.5 mg 和酮康唑 10 mg。主要用于皮肤浅表真菌感染，如手癣、足癣、体癣、股癣等并发湿疹样变的皮损，合并轻度细菌、真菌感染的皮炎、湿疹以及斑块性银屑病。应短期使用。

（5）丙酸氯倍他索咪康唑软膏或乳膏：为超强效糖皮质激素复方制剂，每克含丙酸氯倍他索 0.5 mg 和硝酸咪康唑 20 mg。主要用于严重的顽固性湿疹、皮炎及银屑病等，皮炎、湿疹合并轻度细菌、真菌感染者，也适用于皮肤浅表真菌感染如手足癣并发湿疹样变者。应短期使用。

（6）复方曲安缩松霜：① 5 g；② 15 g。每克含制霉菌素 10 万 U、硫酸新霉素 2.5 mg、短杆菌肽 0.25 mg、曲安缩松 1 mg。用于异位性湿疹、钱币形湿疹、接触性皮炎、脂溢性皮炎、神经性皮炎、中毒性皮炎、外阴瘙痒、肛门瘙痒和婴儿湿疹。用法：①外涂：每日 2 ~ 3 次，药涂于患处。②封闭敷裹疗法：将少量本品擦于患处，直至消失，再涂上一层，在患处盖上一层薄薄包衣，上面再覆盖 1 张无孔薄膜，调换敷料次数视病情而定。每次调换敷料时，必须重新涂药。

16.4.4 用法与用量

（1）外用激素一日应用不超过 2 次。可取适量薄涂在皮肤上。外用制剂不宜混用，两种制剂的使用间隔时间应＞ 30 分钟。对于成年患者，每周外用制剂的最大量推荐如下：面颈，10g；双手，15 g；头皮，15 g；双上肢，30 g；双下肢，50 g；躯干，50 g；腹股沟及外阴，10 g。

（2）剂型的选择：乳膏适用于湿润或有少量渗出的皮损，软膏适于皮肤干燥或有苔藓样变的皮损，洗剂适于头皮部位，硬膏适于革化肥厚的皮损。含有尿素成分的制剂可增加激素渗透和吸收。

16.4.5 注意事项

面部和阴部等皮肤柔嫩及皱褶部位应避免长期外用糖皮质激素制剂。儿童使用强效激素制剂，连续使用不应超过 2 周。婴儿尿布皮炎尤应慎用，外用激素制剂应限于 5 ~ 7 日。用于皮肤薄嫩、擦伤、有糜烂的皮损或大面积使用时会增加激素的局部吸收，严重时可出现系统性不良反应。超强效激素制剂通常只用于严重、顽固的皮炎、湿疹及银屑病皮损，而且只能短期使用，皮损消退后即可停药，再发再用或以弱效糖皮质激素制剂或非糖皮质激素类抗炎剂维持治疗。

含有抗细菌或抗真菌等药物的复方激素制剂，可外用于合并细菌、真菌等感染的皮肤病。应根据所合并皮肤微生物感染的种类和对药物的敏感性，选择相应的复方制剂，短期规律应用，一日 2 次，用 1 周。应用时间久可能导致对抗生素的耐药。

16.4.6 禁忌证

对糖皮质激素或其赋形剂过敏者禁用。外用糖皮质激素不能用于皮肤溃疡或有皮肤萎缩的部位。也不能用于局部有明

显细菌、真菌及病毒感染的疾病。强效及超强效激素不宜大面积使用。任何外用激素制剂均不应长期、大面积使用。

16.4.7 不良反应

（1）播散或加重用药局部的皮肤感染、皮肤萎缩、毛细血管扩张、接触性皮炎、口周皮炎、痤疮、色素沉着或减退及多毛等。

（2）长期外用，尤其外用强效者，可引起激素依赖性皮炎。该皮炎多见于面部，可见红斑、毛细血管扩张和痤疮样丘疹似酒渣鼻样，伴有瘙痒或灼热感。停用激素后，原有疾病皮损可能加重。

（3）长期大面积外用或加封包使用强效、超强效糖皮质激素，由于经皮吸收累积量增加，可发生系统性不良反应，如库欣综合征等。

16.5 皮炎湿疹的药物治疗

16.5.1 皮炎与湿疹

皮炎（dermatitis）与湿疹（eczema）是一组常见的皮肤病。皮炎与湿疹这两个名称间没有明确的界定，可以通用。

湿疹的病因尚不清楚，可能是由人体内部和外部多种因素相互作用引起的一类过敏性皮肤炎症性疾病。按病期可分为急性、亚急性和慢性3期。急性湿疹表现为红斑、丘疹、丘疱疹和水疱，抓破后有糜烂、渗液。亚急性湿疹水疱和渗液减少，出现结痂和脱屑。慢性湿疹以皮肤肥厚、粗糙呈苔藓样变为主。特应性皮炎(atopic dermatitis）是一种特殊类型的湿疹，旧称异位性皮炎，发病与遗传有关。该病分婴幼儿期，儿童期及成人期。

接触性皮炎（contact dermatitis）是皮肤、黏膜接触某些外源性物质引起的炎症反应。长期接触致敏物可引起慢性接触性皮炎，呈慢性湿疹改变。如果因接触酸碱等引起灼伤，称为原发刺激性接触性皮炎，应立即用大量洁净水冲洗。有条件者再用弱酸中和强碱、弱碱中和强酸。如果因变态反应所致，称过敏性接触性皮炎，临床所见接触性皮炎大多属于此类。

神经性皮炎（neurodermatitis）又称慢性单纯性苔藓，好发于中老年人的颈项部、上睑、肘、骶、阴肛等处，该病慢性经过，典型皮损呈苔藓样变，表面皮沟加深、革化肥厚。

脂溢性皮炎（seborrheic dermatitis）是发生在皮脂溢出基础上的一种慢性皮肤炎症。目前认为与糠秕马拉色菌感染有密切关系，好发于头皮、面、背、腋窝和阴部等处。皮疹表现为黄红色斑片，伴油腻性鳞屑，自觉瘙痒。

16.5.2 皮炎湿疹的治疗

首先应寻找原因，并尽量避免。应注意劳逸结合，睡眠充足。多吃蔬菜，保持大便通畅。忌辛辣刺激食物和酒类。有些食物可加重皮损，应留意并避免食用。含油的坚果也不宜多吃。洗澡不宜用过热的水，忌热水烫洗，不宜用对皮肤有刺激作用的肥皂或沐浴露等。洗浴后应外搽润肤药或保湿药，以保持皮肤的润泽。患者应尽量避免搔抓。贴身的衣、被最好用棉制品。

瘙痒严重者可内服抗组胺药如苯海拉明、氯苯那敏等或抗焦虑药如多塞平等。除非有明确病因，如急性接触性皮炎，可系统使用糖皮质激素，否则皮炎湿疹患者应尽量避免系统应用糖皮质激素。对严重、泛发或经一般治疗无效的湿疹患者，可能需要应用免疫抑制药，如短期口服中、小剂量的糖皮质激素，应请皮肤科专科医师诊治，并在病情缓解后逐渐减量；也可采用紫外光治疗。

外用糖皮质激素制剂是治疗皮炎湿疹的主要药物。应根据患者年龄、发生部位、皮疹类型及皮损局部有无感染等选择合适的种类和剂型。急性湿疹仅有红斑丘疹者，可外用中、弱效糖皮质激素制剂，配合炉甘石洗剂消肿止痒。有糜烂渗出者，先采用冷湿敷，如采用0.9%氯化钠溶液、3%硼酸液；糜烂渗出伴有感染者，可用0.02%高锰酸钾溶液、0.05%小檗碱溶液等做冷湿敷，面积广泛者则需分部位进行冷湿敷。湿敷后外用氧化锌糊剂，并与糖皮质激素制剂交替使用。慢性湿疹皮损肥厚、苔藓样变明显者，可选用中、强效糖皮质激素软膏或硬膏，也可用焦油类软膏如黑豆馏油软膏及鱼石脂软膏与外用糖皮质激素

制剂交替使用。瘙痒严重者可用多塞平乳膏等。

比较局限的、合并细菌感染的湿疹皮炎，可使用含抗生素的糖皮质激素外用制剂。抗菌药物不宜长期使用，以免引起抗生素耐药。间擦部位的湿疹常合并念珠菌或真菌感染，可外用含抗真菌药物的糖皮质激素制剂。湿疹继发感染面积较大者可酌情系统使用抗生素。脂溢性皮炎的发病与糠秕马拉色菌有密切关系，头皮脂溢性皮炎可选用含焦油、硫化硒或酮康唑的外用洗剂洗头，面部的皮损可用硫黄软膏或抗真菌外用制剂如酮康唑、咪康唑或联苯苄唑乳膏等。

钙调神经磷酸酶抑制药，如 0.03% 或 0.1% 他克莫司或 1% 匹美莫司软膏适于外用糖皮质激素制剂疗效差或不良反应大的湿疹及特应性皮炎患者，尤其是面部及皱褶部位的皮损。

湿疹、特应性皮炎患者皮肤干燥者，可外用 10% 尿素软膏等保湿药、润肤药，使皮肤保持润泽，这对巩固及维持疗效、预防复发是很重要的。

炉甘石[保(甲)]

Calamine

【适应证】急性瘙痒性皮肤病，如湿疹和痱子。

【注意事项】头发等体毛较长部位一般不用。有显著渗出的皮肤损害者不宜应用。

【禁忌证】有显著糜烂、渗出部位不宜使用。

【不良反应】寒冷季节不宜大面积涂用，否则易受凉。本品较强的收敛作用可使皮肤变得干燥。

【用法与用量】外用：一日多次。

【制剂与规格】炉甘石洗剂：每 1 000 ml 含炉甘石 150 g、氧化锌 50 g、甘油 50 ml。

氧化锌[保(乙)]

Zinc Oxide

【适应证】急性或亚急性皮炎、湿疹、痱子及轻度、小面积的皮肤溃疡。

【注意事项】对有渗出的皮损，最好先做湿敷。使用糊剂或油剂前，可先用纱布蘸液状石蜡或植物油清洁皮损表面。头皮、外阴部位涂药时需将毛发剪短。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】氧化锌软膏：① 10%；② 15%。

氧化锌糊：25%。

(其他见 16.12.3)

糠馏油[保(乙)]

Pityrol

【适应证】皮损肥厚呈苔藓样变的皮肤病，如慢性湿疹、特应性皮炎、神经性皮炎、银屑病等。

【注意事项】糠馏油较煤焦油、松馏油作用缓和，少有刺激性。缺点是有一定气味，污染衣物。

【禁忌证】对本药及其赋形剂过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 2 次。

【制剂与规格】糠馏油软膏：3% ~ 5%。

糠馏油糊：5% ~ 10%。

黑豆馏油[保(乙)]

Pix Fabate Nigrate

【适应证】消炎，收敛，止痒。用于神经性皮炎，慢性湿疹等。

【注意事项】与其他焦油类制剂比较，作用缓和，刺激性微弱。缺点是有一定气味，污染衣物。不得接触眼及黏膜部，涂药部位应避免日光照射。

【用法与用量】外用：一日 1 ~ 2 次。

【制剂与规格】黑豆馏油软膏：① 5%；② 10%。

松馏油

Pine Tar

【适应证】减轻脱屑、瘙痒，用于银屑病、慢性皮炎湿疹。

【注意事项】勿用于眼内，一般不用于面部。有一定气味，可污染衣物。

【禁忌证】不用于急性渗液、糜烂性皮损以及对此成分过敏者。

【不良反应】偶见有接触过敏反应。

【用法与用量】外用：一日 2 次。

【制剂与规格】松馏油软膏：5%。

二硫化硒[保(乙)]

Selenium Sulfide

【适应证】去头屑、头皮脂溢性皮炎、花斑糠疹（汗斑）。

【注意事项】头发用药后应冲洗干净，以免头发褪色。染发或烫发后2日内不得使用该药。避免接触眼睛。本品有毒，禁止口服。

【禁忌证】①皮肤有炎症、糜烂、渗出部位禁用。②外生殖器部位禁用。③对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶可引起接触性皮炎，头发或头皮干燥。少数人头发褪色。

【用法与用量】(1) 治疗脂溢性皮炎，出现泡沫后停留3～5分钟再冲洗干净。一周2次，2～4周为1个疗程。(2) 治疗花斑糠疹，将药液涂于患处，停留10～30分钟后洗净，隔天或一周2次使用，2～4周为1个疗程。

【制剂与规格】二硫化硒洗剂：2.5%。

他克莫司[保(乙)]

Tacrolimus

【适应证】因潜在危险而不宜使用传统疗法、对传统疗法反应不充分或无法耐受传统疗法的中到重度特应性皮炎患者，作为短期或间歇性长期治疗。

【注意事项】(1) 局部有感染者应先治疗感染。(2) 涂药处不采用封包，避免过度暴露于日光和紫外线光源。避免饮酒。避免接触眼结膜。不能长期大面积使用。(3) 0.03%和0.1%浓度的本品均可用于成人，但只有0.03%浓度的本品可用于2岁及以上的儿童。2岁以下儿童不建议使用。

【禁忌证】对他克莫司或制剂中任何其他成分有过敏史的患者禁用。孕妇禁用。对大环内酯类抗生素过敏者禁用。

【不良反应】在外用最初几天局部可有灼热、痒感、红斑、干燥及脱屑。

【用法与用量】①成人和16岁以上，一日2次，外用0.1%软膏剂直到皮损消失。然后减量到一日1次或改用0.03%软膏剂。如果湿疹加重或2周后无改善，则应选用其他治疗。②2～15岁儿童，初始时用0.03%软膏剂，一日2次，皮损控制后减量到一日1次，直到皮损消失。

【制剂与规格】他克莫司软膏：①0.03%；②0.1%。

（其他见8.8）

吡美莫司

Pimecrolimus

【适应证】无免疫受损的2岁及2岁以上轻度至中度异位性皮炎（湿疹）患者，作为短期或间歇性长期治疗。

【注意事项】(1) 不应长期大面积外用。(2) 避免过多暴露于日光和紫外线光源。避免接触眼睛和黏膜。(3) 2岁以下儿童不建议使用。(4) 不能用于急性皮肤病毒感染部位（单纯疱疹、水痘）。(5) 应用本品软膏或乳膏时在用药局部会发生轻度和一过性反应，如用药局部反应严重，则暂停使用。(6) 对儿童不应大面积、长时间使用。(7) 涂药处不封包。

【禁忌证】对吡美莫司或其他聚内酰胺类药物过敏或对任何一种赋形剂过敏者禁用。

【不良反应】局部可有灼热、痒感、红斑、干燥及脱屑。

【用法与用量】外用：一日2次。

【制剂与规格】吡美莫司乳膏：1%。

多塞平[保(乙)]

Doxepin

【适应证】慢性单纯性苔藓，瘙痒症，亚急性、慢性湿疹及异位性皮炎引起的瘙痒。

【注意事项】不能用于眼结膜等黏膜部位。有20%的人外用后可有嗜睡，尤其是超过10%体表面积时，应提醒患者用药后不要驾车或操作危险机器。连续使用不得超过8日。用药时应避免饮酒，因酒能加剧此药的作用。使用前至少2周应停用单胺氧化酶抑制药。

【禁忌证】(1) 因为本品具有抗胆碱作用，而且外用后可在血中检出本品，因此对未治疗的闭角型青光眼或有尿潴留倾向、心功能不全、严重肝肾损伤者以及有癫痫病史者禁用。(2) 既往有严重药物过敏史者禁用。

【不良反应】全身的不良反应一般为嗜睡，还可有口干、头痛、眩晕、疲倦、情绪改变、味觉改变、恶心、焦虑和发热等。局部的不良反应有一过性刺痛感和（或）烧灼感、瘙痒、红斑、皮肤干燥等。

【用法与用量】外用：一日 2 ~ 3 次。连续使用不得超过 8 日。

【制剂与规格】多塞平乳膏：5%。

16.5.3 其他

重组人表皮生长因子[保(乙)]

Recombinant Human Epidermal Growth Factor

【适应证】用于皮肤烧烫伤创面（浅 2 度至深 2 度烧烫伤创面）、残余创面、供皮区创面及慢性溃疡创面的治疗。

【注意事项】(1) 本品为无菌包装，用后请立即旋紧管口，以防污染。(2) 本品无抗菌作用，但不会增加创面感染机会。对感染创面，在进行创面清创的前提下，可考虑联合使用抗菌药物控制感染。对于各种慢性创面，如溃疡、压疮等，在应用本品前，应先行彻底清创去除坏死组织，有利于本品与创面肉芽组织的充分接触，提高疗效。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】偶见轻度刺激症状，如刺痛、灼热感。

【用法与用量】外用：常规清创后，用灭菌 0.9% 氯化钠溶液清洗创面，取本品适量，均匀涂于患处。需要包扎者，同时将本品均匀涂于适当大小的内层消毒纱布，覆盖于创面，常规包扎，一日 1 次或遵医嘱。推荐剂量为每 100 cm^2 创面使用凝胶 10 g。

【制剂与规格】重组人表皮生长因子凝胶：10 g : 100 μg。

樟脑[保(乙)]

Camphor

【适应证】用于瘙痒性皮肤病，纤维组织炎、神经痛、流行性感冒。

【注意事项】(1) 不得用于皮肤破溃处。(2) 避免接触眼睛和其他黏膜（如口、鼻等）。(3) 用后拧紧瓶盖。(4) 用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净，必要时向医师咨询。(5) 孕妇及哺乳期妇女慎用。(6) 过敏体质者慎用。(7) 本品性状发生改变时禁止使用。

【禁忌证】对樟脑和乙醇过敏者禁用。

【不良反应】可引起接触性皮炎。

【用量与用法】患部外搽一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】樟脑酯：10% 樟脑的乙醇溶液。

樟脑软膏：2%。

16.6 银屑病的治疗

银屑病（psoriasis）俗称牛皮癣。皮损特点是表皮增生和脱屑，好发于肢体伸侧和头皮，严重时可泛发全身。治疗前，首先应使患者了解银屑病是一个慢性复发性皮肤病，虽然治疗方法很多，但目前尚无一个一劳永逸根治的方法。首先应教育患者正确对待疾病，对有思想负担的患者，应进行心理治疗。治疗方法的选择应根据病期、皮损范围、性质、部位、年龄等因素而定。对于轻症、限局性银屑病患者，采用局部治疗即可；对于皮损较为广泛、慢性斑块型银屑病患者，除外用药外，可配合光疗如窄波紫外线照射。对急性进行期的点滴型银屑病患者，不能采用有刺激性的外用药；对于泛发性重症银屑病、红皮病型银屑病、泛发性脓疱型银屑病、关节病型银屑病的患者，则应由皮肤科专科医师诊治，需要采用系统用药，包括糖皮质激素、免疫抑制药、维 A 酸类及生物制剂等。

16.6.1 局部治疗药物

银屑病的外用药治疗，常用的有水杨酸维生素 D_3 衍生物、煤焦油、地蒽酚、糖皮质激素制剂及维 A 酸类药物等。

常用的维生素 D_3 和同系物有卡泊三醇、骨化三醇和他卡西醇，具有影响细胞分裂和分化的作用。此类药物无异味也不污染衣服，因而较焦油或地蒽酚制剂更能被患者接受。

外用糖皮质激素是治疗银屑病的有效药物。应遵循以下原则：(1) 适用于皮损局限、处于静止期的银屑病。对局限性斑

块或肥厚的皮损、掌跖部位的银屑病可外用强效激素，必要时可采用封包疗法。也可先用10%水杨酸软膏，去除增厚的角质层后，再用糖皮质激素制剂。(2) 面部、皮肤皱褶部位的皮损可外用弱效至中效糖皮质激素制剂。不能使用强效及超强效糖皮质激素制剂。(3) 头皮银屑病通常鳞屑较多，且较厚、黏着，可先用水杨酸等角质剥脱剂，之后用中强效糖皮质激素，可选用溶液。(4) 不能大面积、长期使用糖皮质激素，尤其是强效及超强效的制剂，以免药物经皮吸收产生系统性不良反应。即使局部外用，连续用药不应超过2周，以避免局部不良反应的发生。为此，糖皮质激素常与其他治疗药物交替使用。(5) 超强效外用激素仅用于银屑病损害，应在专业医师指导下使用。尽管超强效激素可以短期内控制银屑病皮损，但停药后易复发。

对于外用糖皮质激素的禁忌证，注意事项，不良反应，用量用法请参阅糖皮质激素（见5.4.4）。

16.6.2 光疗

光疗（phototherapy）包括单纯以中波紫外线(UVB)、窄波紫外线(NB-UVB)照射，及外用或内服光敏剂甲氧沙林后照射长波紫外线（UVA）（即光化学疗法，PUVA）。其中窄波紫外线照射方法简单、安全有效，目前采用较多。光疗是治疗银屑病的一个有效疗法，尤其适用于皮损泛发、慢性静止期的银屑病患者。对于应用局部治疗无效的中重症银屑病也可使用。光疗应在专业医师的指导下进行。过高的剂量可造成严重的全身及皮肤反应，甚至可激惹银屑病。

16.6.2.1 光化学疗法

UVA照射联合补骨脂素（PUVA）。口服或局部外用补骨脂素以增强紫外线照射的作用。PUVA对多种类型的银屑病有效，包括局限性掌跖脓疱型银屑病。早期不良反应包括光毒性和瘙痒。口服补骨脂素（详见白癜风部分）可有消化道的不良反应，如恶心、呕吐等。服药后应注意光防护。长期治疗由于高累计剂量可加速皮肤老化、增加白内障及皮肤肿瘤，尤其是鳞状细胞癌发生的风险。

16.6.2.2 窄波紫外线疗法

窄波紫外线疗法为波长311 nm的紫外线照射。由于无须服药，照射时间短，治疗后无须光防护，治疗效果不亚于PUVA，因此近年来得到广泛应用。

16.6.2.3 联合治疗药物

光疗可配合煤焦油、地蒽酚或维生素D_3衍生物外用，以提高疗效。

16.6.3 系统治疗药物

系统治疗应在皮肤科专科医师指导下进行。系统治疗用于重症、泛发、对外用药治疗效果不好、顽固的寻常型银屑病及脓疱病型、关节病型和红皮病型银屑病。系统用药主要包括：维A酸类，免疫抑制药如环孢素、甲氨蝶呤，系统性糖皮质激素及生物制剂等。本处只介绍它们在银屑病方面的应用，详细请参阅相应部分。

(1) 依曲替酸是阿维A酯在体内的代谢产物，生物活性强，主要用于银屑病的治疗，一般在服药2～4周后起效，最佳疗效多在治疗4～6周后获得。需要特别指出的是阿维A有致畸性，育龄女性治疗前必须排除妊娠的可能性，治疗中和停药后2年内要采取有效的避孕措施，同时应定期监测肝功能和血脂浓度。

(2) 免疫抑制药

甲氨蝶呤[保(甲)] 是一种代谢类抗肿瘤药，属细胞周期特异性药物，主要作用于细胞周期的S期。内服可应用于皮损泛发、其他方法治疗效果不佳、顽固的银屑病患者。第一种用药方法为每周分次剂量方案(即36小时疗法)，每周共服用7.5 mg，方法为每12小时服用2.5 mg，连续服用3次。第二种用药方法为一周1次方案，一次口服10～15 mg，持续服用，以达到最佳临床疗效。期间可对剂量作适当调整。达到最佳疗效后，服药剂量应减少，服用间期应延长。对本药过敏、妊娠期妇女、严重肝肾功能不全者、有骨髓抑制者禁用，有感染性疾病者、消化性溃疡或溃

疡性结肠炎者慎用。甲氨蝶呤常见的不良反应为，肝损害，AST 及 ALT 升高，可出现黄疸，长期内服可导致肝细胞坏死，肝纤维化甚至肝硬化；白细胞和血小板减少，长期内服可引起骨髓抑制；胃肠道不适，常见食欲缺乏，出现口腔炎等。因此，在服药期间必须定期检查肝肾功能、血尿常规等。对长期服用者应予特别注意，必要时做肝穿刺、骨骼穿刺检查。(其他见10.3.1.2)

环孢素[保(甲)] 是一种T淋巴细胞功能调节药，主要用于预防器官移植后发生的排斥反应。在皮肤科该药可用于自身免疫性疾病，如天疱疮、大疱性类天疱疮、有肾损害的系统性红斑狼疮等患者。对顽固难治、皮损广泛的寻常型银屑病及脓疱病型、关节病型和红皮病型银屑病可内服环孢素，方法为一日 3 ~ 5 mg/kg，达到最佳疗效后逐渐减量。对本药过敏、有严重心肺疾患、未控制的高血压患者，妊娠及哺乳期妇女禁用；肝肾功能不全、患有感染性疾病、高血压患者（已控制），年龄＞65 岁者慎用。本药不能与氟康唑、酮康唑等同时服用。常见的不良反应有食欲缺乏、肾功能受损（包括血清肌酐、尿素氮升高）、高血压、电解质紊乱等，长期服用可出现牙龈肿胀、多毛等。服药期间应定期检查肝肾功能、血尿常规、血电解质水平、血压等，同时应监测本药的血药浓度。(其他见 8.8)

雷公藤多苷[基(基)，保(甲)] 体外试验表明有较强的抗炎作用和免疫抑制作用，可用于结缔组织病如红斑狼疮、皮肌炎、白塞病、血管炎、各型银屑病等。口服，一次 10 ~ 20 mg，一日 3 次。(其他见 7.1.2.3)

依那西普 用于关节病型银屑病，也用于对系统治疗包括环孢素和甲氨蝶呤及光疗无效的成人重症斑块型银屑病、不能耐受系统治疗或对系统治疗有禁忌证的成人重症斑块型银屑病。成人推荐剂量为一次 25 mg，一周 2 次皮下注射，注射部位可为大腿、腹部和上臂；儿童推荐剂量为一周 400 μg/kg，最大剂量为 50 mg，分 2 次皮下注射。如在 12 周治疗后，效果仍然不佳，应停止使用。(其他见 7.1.2.4)

卡泊三醇[保(乙)]

Calcipotriol

【适应证】寻常性银屑病。

【注意事项】这类药物吸收可影响体内钙代谢，禁用于钙离子代谢异常患者，也不宜长期、大面积使用，以免增加高钙血症的风险。软膏制剂避免用于面部；妊娠期妇女慎用。不能与水杨酸制剂合用。用后应洗去手上残留药物，以避免刺激正常皮肤。

【禁忌证】对本品过敏者或钙代谢失调者应禁用。

【不良反应】局部皮肤刺激症状，可出现红斑、烧灼感、瘙痒等症状，还可引起光敏反应。

【用法与用量】(1) 软膏外用，一日 1~2 次，一周用量不应超过 100 g。(2) 搽剂用于头皮银屑病，一日 1 ~ 2 次，一周用量不应超过 60 ml，儿童不建议使用。

【制剂与规格】卡泊三醇软膏：1g：50μg（0.005%）。

卡泊三醇搽剂：1 ml：50μg。

他卡西醇

Tacalcitol

【适应证】寻常性银屑病。

【注意事项】尚未有血清钙值上升的临床报道，但因本品为活性维生素 D_3 制剂，与类似药品如活性型维生素 D_3 外用制剂合用或大剂量涂抹时有血清钙值上升可能性。另外，还有引起伴随高钙血症的肾功能低下的可能性。因此，在与类似药制剂合用或大剂量给药时，应注意观察血清钙及尿液中的钙含量和肾功能状况如肌酸酐、BUN 等。不用于眼角膜、结膜。妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】对本品成分有过敏者禁用。有钙代谢性疾病者禁用。

【不良反应】局部皮肤刺激症状如红斑、瘙痒等。

【用法与用量】外用：一日 1 ~ 2 次，一日用量不应超过 10 g。

【制剂与规格】他卡西醇软膏：1 g：

2μg（0.000 2%）。

煤焦油[保（乙）]

Coal Tar

【适应证】头部银屑病、脂溢性皮炎以及去除头皮屑。

【注意事项】应避免用于眼及黏膜部位，避免用于皮肤破溃部位。有光敏作用，不用于面部。不用于急性渗出、糜烂性皮损及皮肤感染部位。

【禁忌证】对焦油类过敏者禁用；光敏性皮肤病患者禁用。

【不良反应】局部皮肤刺激症状如红斑、瘙痒等。焦油刺激可产生毛囊炎；偶见皮肤过敏。

【用法与用量】(1) 外用于患处，一日 1 ~ 2 次。(2) 搽剂可代替香波用于头皮银屑病，一周 3 ~ 4 次。

【制剂与规格】煤焦油洗剂：1%。

地蒽酚[保（乙）]

Dithranol

【适应证】寻常性斑块状银屑病。

【注意事项】避免用于眼周和皮肤敏感部位。避免接触眼及黏膜部位。不能用于皮肤破溃处。不能用于面部、外阴部及皮肤皱褶部位。用药后应立即洗去手上残留药物，以防刺激皮肤。本药治疗应从低浓度、小面积及短疗程开始，根据皮肤的耐受性及皮损反应，逐渐增加浓度、扩大用药面积及增加药物接触时间。用药期间若邻近正常皮肤出现红斑、灼热等反应，应降低药物浓度、减少给药次数及药物存留时间。

【禁忌证】对地蒽酚类化合物过敏者禁用，对脓疱性银屑病患者禁用。

【不良反应】主要的不良反应是对皮肤有刺激作用，引起发红、灼热、瘙痒等症状。指甲可染为红褐色，并使衣物染色。

【用法与用量】治疗应从低浓度如 0.1% 开始，根据耐受程度逐渐增加药物浓度如 0.25%、0.5%、1.0%，最高可至 3%。一般每日晚上涂药，次日清晨洗去，白天涂润肤药以保持皮肤润泽。对较厚的皮损，可先用角质溶解药，再用本品。

【制剂与规格】地蒽酚软膏或地蒽酚蜡棒：① 0.05%；② 0.1%；③ 0.25%；④ 0.5%；⑤ 1.0%；⑥ 2%；⑦ 3%。

他扎罗汀

Tazarotene

【适应证】寻常性斑块状银屑病及寻常痤疮。

【注意事项】应避免接触眼睛及其他黏膜部位；不能用于擦烂区、头皮毛发覆盖处、湿疹化皮肤；不能用于急性皮炎湿疹类皮肤病；使用后应立即洗净手上残留的药物；治疗期间避免过度暴露于紫外线，包括阳光、日光浴、PUVA 或 UVB 治疗；用药同时不应使用可致皮肤干燥的药物或化妆品。育龄妇女在用药前需确认未妊娠。服用具有光敏性药物的患者慎用。

【禁忌证】(1) 孕妇、哺乳期妇女及近期有生育愿望的妇女禁用。(2) 对本品或其他维 A 酸类药物过敏者禁用。

【不良反应】局部刺激较为多见，表现为瘙痒、烧灼感、红斑、脱屑、皮炎、皮肤干燥等；偶见刺痛和皮肤发红、皮肤干燥和疼痛。若不能耐受则应及时停药。

【用法与用量】每天睡前半小时左右局部外用 1 次。将凝胶均匀涂于皮损上，轻轻揉搽。外用面积不应超过体表面积的 20%。18 岁以下儿童及 65 岁以上老人不推荐使用。

【制剂与规格】他扎罗汀凝胶：① 15 g ∶ 15 mg；② 30 g ∶ 30 mg。

阿维 A[保（乙）]

Acitretin

【适应证】(1) 严重的银屑病，包括红皮病型银屑病、脓疱型银屑病等。(2) 其他角化性皮肤病。

【注意事项】育龄妇女在开始阿维 A 治疗前 2 周内，必须进行妊娠试验，确认妊娠试验为阴性后，在下次正常月经周期的第 2 日或第 3 日开始用阿维 A 治疗。在开始治疗前、治疗期间和停止治疗后至少 2 年内，必须使用有效的避孕方法，避免妊娠。治疗期间，应定期进行妊娠试验，如妊娠试验为阳性，应立即与医师联系，共同讨论对胎儿的危险性及是否继续妊娠等。在阿维 A 治疗期间或治疗后 2 个月内，

应避免饮用含乙醇的饮料，并忌酒。在服用阿维A前和治疗期间，应定期检查肝功能。若出现肝功能异常，应每周检查。若肝功能未恢复正常或进一步恶化，必须停止治疗，并继续监测肝功能至少3个月。对有脂代谢障碍、糖尿病、肥胖症、酒精中毒的高危患者和长期服用阿维A的患者，必须定期检查血清胆固醇和三酰甘油。对长期服用阿维A的患者，应定期检查有无骨异常。正在服用维A酸类药物治疗及停药后2年内，患者不得献血。治疗期间，不应使用含维生素A的制剂或保健食品，应避免在阳光下过多暴露。

【禁忌证】妊娠及哺乳期妇女及2年内有生育计划的妇女禁用。对阿维A或其他维A酸类药物过敏者禁用。严重肝肾功能不全者、高脂血症者，维生素A过多症或对维生素A及其代谢物过敏者禁用。

【不良反应】主要和常见的不良反应为维生素A过多综合征样反应，主要表现为：(1) 皮肤瘙痒、感觉过敏、光过敏、红斑、干燥、脱屑、甲沟炎等。(2) 唇炎、鼻炎、口干等。(3) 眼干燥、结膜炎等。(4) 肌痛、背痛、关节痛、骨增生等。(5) 神经系统：头痛、步态异常、颅内压升高、耳鸣、耳痛等。(6) 其他：疲劳、厌食、食欲改变、恶心、腹痛等。(7) 实验室异常：可见ALT、AST、碱性磷酸酶、三酰甘油、胆红素、尿酸、网织红细胞等短暂性轻度升高，也可见高密度脂蛋白、白细胞及磷钾等电解质减少，继续治疗或停止用药，改变可恢复。

【用法与用量】本品个体差异较大，剂量需要个体化，才能取得最大的临床治疗效果，同时不良反应最小。(1)开始治疗：阿维A治疗应为一日25 mg或30 mg，作为一个单独剂量与主餐一起服用。如果经过4周治疗效果不满意，又无毒性反应，每天最大剂量可以逐渐增加至70 mg。(2) 维持治疗：治疗开始有效后，可给予一日25～50 mg的维持剂量。维持剂量应以临床效果和耐受性作为根据。一般来说，当皮损已充分消退，治疗应该停止。复发可按开始治疗的方法再治疗。(3) 其他角化性疾病：角化性疾病的维持剂量为一日10 mg，最大为一日50 mg。

【制剂与规格】胶囊：每丸10 mg。

16.7 痤疮的药物治疗

痤疮（acne）是青春发育期由于雄激素增多，致皮脂腺毛囊管壁角化并堵塞毛孔造成皮脂排出不畅，从而引起毛囊皮脂腺的炎症反应，同时与痤疮丙酸杆菌感染有关。根据皮损的严重程度，可将痤疮分为轻、中、重三度。

痤疮治疗应尽早开始以防止形成瘢痕。医师应告知患者本病并非内分泌的紊乱所致，而是青春期的一个常见现象，渡过了青春期后，症状可以自然消退。治疗的目的是使其减轻，同时治疗过程中可能有反复，特别在女性，可能随月经周期的变化而时轻时重。治疗方法的选择主要取决于痤疮的严重程度。轻度到中度痤疮一般采用局部治疗。中度到重度痤疮患者，除局部用药外，可配合系统治疗。如口服抗生素（四环素、米诺环素等），女性患者可口服激素如孕酮和炔雌醇，结节及囊肿性痤疮患者可在皮肤科医师指导下口服异维A酸等治疗。

为了减少痤疮丙酸杆菌等的耐药性，应做到以下3点：①尽可能使用非抗生素类抗菌药，如过氧苯甲酰或壬二酸。②如果某种抗生素有效，可重复使用该药物数疗程，疗程的间歇配合使用过氧苯甲酰或壬二酸。③外用抗生素的疗程为4～8周，在此基础上一旦没有用药指征，应停药。

过氧苯甲酰[保（乙）]

Benzoyl Peroxide

【适应证】寻常痤疮。

【注意事项】仅供外用。如果出现严重刺激反应应立即停药并予以适当治疗。症状消退后可重新恢复治疗，注意开始时用药次数要减少。本品不得用于眼睛周围或黏膜处，避免接触毛发和织物。本品和有颜色物接触时，可能出现漂白或褪色现象。避免接触部位过度日光照晒。

【禁忌证】对本药过敏者禁用；皮肤急性炎症或破溃者禁用。

【不良反应】可能出现过敏性接触性皮炎和干燥现象。

【用法与用量】用温和的香皂和清水清洗患处，一日 1 ~ 2 次涂用本药。

【制剂与规格】过氧苯甲酰乳膏或凝胶：① 2.5%，10g∶0.25g；② 5%，10g∶0.5g；③ 10%，10 g∶1.0 g。

红霉素过氧苯甲酰凝胶：含红霉素 3%，过氧苯甲酰 5%。

壬二酸

Azelaic Acid

【适应证】寻常痤疮，丘疹脓疮期酒渣鼻。

【注意事项】避免接触眼部及口腔等黏膜部位。

【禁忌证】对本药过敏者。

【不良反应】局部刺激反应，偶见皮肤脱色，罕见光敏感。

【用法与用量】涂于患处：一日 2 次。

【制剂与规格】乳膏剂：① 15%；② 20%。

克林霉素[保（乙）]

Clindamycin

【适应证】有炎性丘疹及脓疱等合并感染的寻常痤疮。

【注意事项】应避免接触眼睛和其他黏膜。局部吸收后也可能引起腹泻，应立即停药。请勿将本品用于其他细菌引起的皮肤感染。妊娠及哺乳期妇女、12 岁以下儿童慎用。过敏体质者慎用。不宜与红霉素类联合使用。

【禁忌证】有肠炎或溃疡性结肠病史者禁用。对本品过敏者禁用。

【不良反应】可引起皮肤干燥，局部刺激、皮疹等过敏反应。偶见胃肠不适及腹泻。

【用法与用量】涂于患处：一日 2 次，早、晚各 1 次，4 周为 1 个疗程。

【制剂与规格】克林霉素磷酸酯溶液或凝胶或搽剂：1%。

（其他见 9.3.8）

维 A 酸[基（基）．保（甲）]

Tretinoin

【适应证】寻常痤疮，特别是粉刺类损害，扁平疣、皮肤及毛囊角化异常性病变、寻常型银屑病。

【注意事项】晒伤、酒渣鼻患者不宜使用。不宜用于皮肤皱褶部位。用药期间避免同时使用含磨砂剂、易引起粉刺或有收敛作用的化妆品。避免同时采用局部光疗照射。避免用于大面积严重痤疮，避免接触眼、鼻、口腔黏膜。育龄妇女使用时须避孕。

【禁忌证】(1) 妊娠初始 3 个月内、哺乳期妇女禁用。(2) 对本品任何成分过敏者禁用。(3) 眼部禁用。(4) 急性或亚急性皮炎、湿疹类皮肤病患者禁用。

【不良反应】局部反应包括烧灼感、红斑、刺痛、瘙痒、皮肤干燥或脱屑，对紫外光敏感性增强。可出现一过性皮肤色素沉着。用于眼周可出现局部刺激和水肿、脱屑。

【用法与用量】涂于患处：每晚 1 次。一日量不应超过 20 g（乳膏或软膏剂）

【制剂与规格】维 A 酸乳膏或软膏：① 0.1%；② 0.025%。

维 A 酸凝胶：① 0.1%；② 0.025%。

（其他见 6.5.2.2）

阿达帕林[保（乙）]

Adapalene

【适应证】以粉刺、丘疹和脓疱为主要表现的寻常型痤疮，面部、胸和背部的痤疮。

【注意事项】如果产生过敏或严重的刺激反应，应停止用药；使用药物期间，如果暴露在日光下，应将剂量降低到最小用量；避免接触眼、唇、口腔、鼻黏膜、内眦和其他黏膜组织；不应用在刀伤、擦伤、湿疹或晒伤的皮肤上，也不得用于十分严重的痤疮患者，或患有湿疹样的皮肤创面。当用其他维生素 A 类药或使用“蜡质”脱毛方法时，应避免使用本品进行治疗。不能同时擦乙醇或香水，使用本品时要保持皮肤清洁干燥。

【禁忌证】对阿达帕林或凝胶赋形剂中的任何组分过敏者禁用。

【不良反应】在最初治疗的 2 ~ 4 周里最常见的不良反应为红斑、干燥、鳞屑、瘙痒、灼伤或刺痛，较少发生的不良反应有晒伤、皮肤刺激、皮肤不适的烧灼和刺

痛。极少发生的不良反应包括痤疮红肿、皮炎、眼水肿、结膜炎、红斑、瘙痒、皮肤变色、红疹和湿疹等。如不良反应严重，应减少用药次数或停药。

【用法与用量】涂于患处：每晚 1 次。

【制剂与规格】阿达帕林凝胶：0.1%。

异维 A 酸[保（乙）]

Isotretinoin

【适应证】重度痤疮（尤其是结节囊肿型痤疮），毛发红糠疹。

【注意事项】异维 A 酸不良反应较大，有致畸作用，应在皮肤科医师指导及监视下用药，用药前应排除妊娠，在月经周期的第 2 日或第 3 日开始治疗，女性必须在治疗期间、治疗后做好避孕，直至治疗结束后 3 个月。如果在治疗过程中妊娠，必须行人工流产。治疗期间或治疗后 1 个月避免献血；治疗后 1 个月以及之后每 3 个月检查肝功能和血脂，如血脂或转氨酶持续升高应减量或停药；如果在治疗期间发生精神紊乱等表现，应停止服用，并建议精神科专家会诊。儿童不推荐使用。糖尿病、肥胖症，酗酒及脂质代谢紊乱者慎用。

【禁忌证】孕妇，哺乳期妇女，肝肾功能不全、维生素 A 过量及高脂血症患者禁用。

【不良反应】患者在服药后面部出油明显减少，同时感到皮肤、黏膜包括口唇、眼、鼻黏膜干燥、脱皮；鼻出血；头痛、肌肉关节痛；血脂升高；可使肝酶升高；有报道服药后出现精神变化，如抑郁、自杀倾向、焦虑；脱发；偶见恶心、过敏反应及光敏。妊娠期妇女服药后可致自发性流产及胎儿发育畸形。

【用法与用量】开始剂量为 0.1 ~ 1 mg/kg 不等，推荐一日 0.5 mg/kg，分 2 ~ 3 次服用，4 周后改用维持量，维持量视患者耐受情况决定，但一日最高剂量不得超过 1 mg/kg，饭间或餐后服用，一般 6 ~ 8 周为 1 个疗程。如需要，停药 8 周后，再进行下 1 个疗程。

【制剂与规格】异维 A 酸胶囊：① 5 mg；② 10 mg。

16.8 酒渣鼻的药物治疗

酒渣鼻（rosacea）是一种发生于鼻面中部的慢性皮肤病，可伴发脂溢性皮炎，病因未明。按临床特点分为红斑期、丘疹脓疱期及鼻赘期。治疗酒渣鼻首先应该去除诱因，如避免刺激性食物，丘疹脓疱期可外用或口服药物治疗，鼻赘期可行整形手术。

外用药物有甲硝唑和壬二酸。口服药物如四环素、米诺环素、红霉素，适于丘疹脓疱期皮损，甲硝唑或替硝唑适于有多数毛囊虫的患者。

甲硝唑[基（基），保（乙）]

Metronidazole

【适应证】毛囊虫皮炎、疥疮、痤疮。其他如滴虫阴道炎、外阴炎的局部辅助治疗。

【禁忌证】对甲硝唑有过敏者、儿童及酗酒者禁用。

【不良反应】短暂红斑、皮肤干燥、烧灼感、皮肤刺激性反应。

【用法与用量】涂于患处：一日 2 次

【制剂与规格】甲硝唑乳膏或凝胶：① 0.75%；② 1%。

（其他见 9.3.12）

16.9 多汗症的药物治疗

多汗症（hyperhidrosis）指皮肤出汗异常过多的现象。原因有器质性和功能性两种，前者见于内分泌失调、神经系统疾患及感染等；后者由情绪紧张等精神因素引起。可分为局限性多汗症及全身性多汗症，以局限性多汗症为多见，其中以手掌多汗症和腋窝多汗症更为常见。

多汗症根据不同病因给予相应治疗。因全身疾病引起者，应针对全身疾病治本；因精神因素引起者，则应作精神治疗，对患者耐心解释，避免精神紧张。局部治疗原则为抑制汗液分泌、干燥、收敛。常用铝盐的水溶液，如醋酸铝溶液、明矾溶液（5%）、氯化铝溶液（20% ~ 25%）、腋部还可试用氯化铝乙醇溶液（6.25%），也可用格隆溴铵电离子透入治疗。

醋酸铝

Aluminium

【适应证】用于腋窝、手部或足部多汗症，

【注意事项】避免接触眼部和黏膜；避免接触破损部位或敏感部位皮肤；使用后12小时内不得剃腋毛或脱毛；避免直接接触衣物，使用前必须洗净患处，且使其干燥。

【不良反应】对皮肤有一定刺激性。外用于腋窝部多汗症时易发生刺激作用，使用时须小心。

【用法与用量】溶液剂可于夜间涂于干燥皮肤处，清晨洗净，最初一日1次，待情况好转后减少使用频率，使用后勿立即洗澡。0.5%醋酸铝溶液，一日1次浸泡，一次15～30分钟；也可用5%明矾溶液。20%～25%氯化铝溶液，涂搽患处，一日1～2次。

【制剂与规格】醋酸铝溶液：0.5%。

格隆溴铵

Glycopyrronium Bromide

【适应证】手足限局性多汗症。

【注意事项】有皮肤感染时不应使用。

【禁忌证】对本药及其他抗胆碱能药过敏者。

【不良反应】用药部位可有针刺感。

【用法与用量】以0.1%溶液作电离子透入疗法。1次仅用1个部位，24小时内最多治疗2个部位，7日内不进行重复治疗。

16.10 白癜风的药物治疗

白癜风（vitiligo）是一种后天获得性色素脱失性皮肤病，病因不完全清楚，可能的致病因素包括遗传因素、免疫功能异常和内分泌因素等，导致黑素细胞破坏或酶系统抑制、黑素体生成障碍，从而产生色素脱失。白癜风可分为进展期和稳定期。治疗一般以外用药物为主，可应用甲氧沙林治疗。对于稳定期的皮损，可采用自体表皮移植手术或自体表皮黑素细胞移植手术。窄波紫外线（NB-UVB）适用于皮损泛发、皮损处于稳定期白癜风患者的治疗。一般一周照射2～3次，需连续治疗3～6个月。

甲氧沙林[保(乙)]

Methoxsalen

【适应证】白癜风。

【注意事项】口腔、眼、黏膜周围及皮肤破溃处不宜使用。仅外搽于病变部位，尽量避免外用于正常皮肤。在外用后配合长波紫外线或日光照晒，照射的剂量或时间应在专科医师指导下逐渐增加。照射紫外线时应戴墨镜，并用黑布覆盖正常皮肤。有皮肤癌病史、日光敏感家族史、新近接受放射线或细胞毒药物治疗及有胃肠道疾病者应慎用。治疗期间不得服用含有呋喃香豆素的食物，如酸橙、无花果、香菜、芥末、胡萝卜、芹菜等。治疗期间应戒酒，不宜吃过于腥的食物。治疗白癜风疗效出现较慢。

【禁忌证】12岁以下儿童、年老体弱者禁用，孕妇及哺乳期妇女禁用；严重肝病患者禁用；白内障或其他晶体疾病患者禁用；有光敏性疾病如红斑狼疮、皮肌炎、卟啉症、多形性日光疹、着色性干皮病等患者禁用；对本品过敏者禁用。

【不良反应】配合长波紫外线照射后常见的不良反应是红斑，常在照射24～28小时出现；皮肤色素沉着，瘙痒。若照射剂量过大或时间过长，照射部位皮肤上可出现红肿、水疱、疼痛、脱屑，如有红肿、水疱等可暂时停用，待恢复后再用。

【用法与用量】外用：患处涂搽1～2小时后，用长波紫外线照射患处。照射时光距为10～30 cm，照射30分钟左右。一日1次。一般1个疗程为1个月。治愈后，每周或隔周照射1次以巩固疗效。如未治愈应继续治疗。如2个疗程结束，皮损仍无明显消退，可停止治疗。治愈后如有复发，重复治疗仍然有效。

【制剂与规格】甲氧沙林溶液剂或二甲基亚砜溶液：0.1%～0.3%。

16.11 黄褐斑的药物治疗

黄褐斑（malasma）是发生于面部的形状不规则、边界清楚的淡褐色或淡黑色

斑，病因不明确，可能与妊娠、口服避孕药、日光照射、外用化妆品以及精神抑郁等有关。

氢醌[保(乙)]

Hydroquinone

【适应证】黄褐斑，轻度雀斑，其他皮肤色素沉着改变。

【注意事项】用药期间和用药后避免日晒；避免药物接触眼、口唇黏膜；避免用于敏感或受损皮肤；避免大面积使用；含亚硫酸盐的氢醌制剂能导致某些患者如哮喘患者的过敏反应；不推荐用于12岁以下儿童；哺乳期妇女慎用；药物应避免潮湿和光照。

【禁忌证】对本品过敏者；妊娠期妇女。

【不良反应】皮肤干燥、红斑、烧灼、水疱感等刺激症状；荨麻疹、呼吸困难等过敏症状；皮肤颜色加深。

【用法与用量】涂于患处：一日2次。

【制剂与规格】氢醌乳膏：① 2%；② 4%。

16.12 皮肤病的辅助治疗用药

正常皮肤富含水分，角质层虽然是死亡的角质形成细胞，但具有重要的屏障功能，是机体抵御各种外界刺激的第一道防线。不少皮肤病使皮肤屏障结构和（或）功能受损，经表皮水分丢失增加，造成皮肤干燥、对环境刺激敏感等不适，此时使用具有润肤、保湿等功能的制剂常可获得很好的效果，与传统的外用药物联合使用，可提高疗效。皮肤科将此类治疗称为辅助治疗。辅助治疗的主要目的是增加皮肤的水合作用，也就是增加皮肤角质层的含水量，恢复皮肤的屏障功能。其中润肤药、保湿药、屏障保护药等在辅助治疗中担当主要角色。这类制剂可作为日常的护肤品使用，尤其在气候干燥的地区，也常在洗澡或沐浴后使用。

润肤药、保湿药、屏障保护药等在我国大多作为保健护肤品在药房或超市可购得。

16.12.1 润肤药

润肤药（emollients）通过油性软膏或水溶性乳膏及其基质（如凡士林、液状石蜡等）减轻皮肤干燥、脱屑，提高皮肤的水合作用，使皮肤变得平滑、滋润，有光泽。适用于各种干燥及鳞屑性皮损。润肤药的作用持续时间较短，因此在症状得到缓解后仍需经常使用。极少数患者可能对润肤药中的某些成分过敏，如果患者皮肤发生湿疹样反应需警惕致敏。

常用的有羊毛脂软膏、二甲硅油制剂等。

尿素可作为水合剂使用，可用于鳞屑性皮损包括鱼鳞病，对缓解老年皮肤干燥也有益处。有时可与其他外用药物如糖皮质激素软膏合用。

羊毛脂软膏

Wool Fat Ointment

【适应证】皮肤干燥、干皮病、皮肤皲裂、乏脂性湿疹、鱼鳞病、冬季瘙痒症、慢性剥脱性皮炎等。

【禁忌证】对有关成分过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日2～3次。

二甲硅油乳膏[保(乙)]

Silicone Fluid Cream

【适应证】用于保护、滋润皮肤。

【注意事项】勿入眼内。

【用法与用量】外用：一日2次。

【制剂与规格】二甲硅油乳膏：15%二甲硅油、10%甘油、硬脂酸、丙二醇、液状石蜡、纯化水。

复方二甲硅油乳膏：14%二甲硅油、5%甘油、硬脂酸、丙二醇、液状石蜡、尿囊素、沙棘油、纯化水。

复方乳酸软膏

Compound Lactic Acid Ointment

【适应证】手足皲裂症和鱼鳞病。

【注意事项】避免接触眼睛；涂抹部位如有灼烧感、瘙痒、红肿等，应停止用药，洗净。

【禁忌证】对乳酸、尿素及化学结构类似物有过敏史者禁用。

【用法与用量】外用：一日2～3次。

【制剂与规格】复方乳酸软膏：10 g，含乳酸1.2 g、尿素1.5 g。

尿素软膏[基(基)、保(甲)]

Urea Ointment

【适应证】皮肤角化症、手足皲裂、干皮症、鱼鳞病等。

【注意事项】勿入眼内。高浓度软膏(30% ~ 40%)用于甲真菌病，有软化剥离病甲作用。

【禁忌证】对有关成分过敏者禁用。

【不良反应】个别有局部刺激现象。

【用法与用量】外用：一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】尿素软膏：20%。

尿囊素

Allantoin

【适应证】皮肤干燥、干皮病、皮肤皲裂、乏脂性湿疹、鱼鳞病、冬季瘙痒症等。

【注意事项】勿入眼内。

【禁忌证】对有关成分过敏者禁用。

【不良反应】罕见局部刺激现象

【用法与用量】外用：一次 2 ~ 3 g，一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】尿囊素软膏：0.2 g : 20 g。

尿囊素乳膏：0.2 g : 20 g。

16.12.2 保湿药

人体皮肤的含水量，特别是角质层的含水量与皮肤的光洁度、弹性和柔软性密切相关。人体皮肤中油脂、水和天然保湿因子组成了天然保湿系统，维持着正常的皮肤水合度，使皮肤保持润泽。保湿药系含有保湿成分，能增加皮肤水分、湿度的护肤品。根据其作用机制，可分为封包性保湿药和润湿／吸湿性保湿药。前者主要是一些油脂类物质，后者主要含天然保湿因子和蛋白质等。

(1) 封包性保湿药：主要是油脂类物质，外涂于皮肤后，在角质层外形成一层油性膜，通过封闭作用阻止水分从表皮丢失，达到保湿效果。常用的此类保湿药多含有如下成分：①矿物油和蜡类，凡士林、矿物油和液状石蜡；②硅油类；③植物或动物脂肪，可可脂，羊毛脂；④脂肪酸类，羊毛脂酸、硬脂酸、亚麻酸、花生酸、十六烷基酯；⑤植物与动物蜡，巴西棕榈蜡、烛蜡、蜂蜡；⑥磷脂和胆固醇类。其中有些制剂已在润肤药部分中提及，此处不再赘述。

(2) 润湿／吸湿性保湿药：主要含有天然保湿因子和蛋白质、多糖等大分子物质，具有吸水／保水作用，是一种水分补充体。当皮肤水分丢失时，这些保湿因子可携带水分渗透到皮肤内，主动补充水分，或将水分包裹起来，不再丢失，或渗透到表皮和角质层内，吸收来自真皮的水分，提高表皮的水合度，达到保湿的效果。与封包性保湿药比较，润湿／吸湿性保湿药更加清爽，不油腻。此类保湿药多含有如下成分：氨基酸、吡咯烷酮羧酸、乳酸、尿素、葡萄糖胺、甘油、蜂蜜、丙二醇、明胶蛋白、维生素、玻璃酸、黏多糖等。

保湿药的主要作用是维持正常的皮肤水合度，使皮肤保持润泽。适用于皮肤干燥、乏脂性湿疹、冬季瘙痒症及红皮病等的护理，也适用于特应性皮炎等的维持治疗。一般而言，这类制剂外搽后无不良反应，是很安全的。个别可对制剂中成分、特别是添加的防腐剂、香料等过敏。这类制剂可作为日常的护肤品使用，尤其在气候干燥的地区。

16.12.3 屏障保护药

屏障保护药 (barrier preparations) 是指可以暂时、部分代替皮肤屏障作用和功能的一组制剂，通常含有防水成分和收敛性物质，如氧化锌、二甲硅油或其他硅树脂等。皮肤屏障功能或结构受损时，皮肤易发生刺激、敏感，并常伴发细菌／真菌感染。使用屏障保护药可以缓解局部渗出和不适，预防和减轻局部感染。但此类产品对皮肤的保护作用有限，一般不能治疗原发疾病，没有直接的抗过敏、抗炎和抗感染作用。

鞣酸

Tannic Acid

【适应证】烧伤、痔疮、褥疮、尿布皮炎、新生儿臀红、间擦疹等。

【注意事项】勿接触眼内。

【禁忌证】对此成分过敏者禁用。

【不良反应】偶见轻度局部刺激。

【用法与用量】外用：一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】鞣酸软膏：20%。

氧化锌[保（乙）]

Zinc Oxide

【适应证】用于急性或亚急性皮炎、湿疹、痱子及轻度、小面积的皮肤溃疡。

【注意事项】勿接触眼内。

【禁忌证】对此成分过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】氧化锌软膏：① 10%；② 15%。

氧化锌糊：25%。

复方氧化锌糊：含氧化锌 30%、植物油 30%。

复方醋酸铝糊：含氧化锌 12%、醋酸铝溶液 16.7%、淀粉 12%。

氧化锌油：含氧化锌 40%。

16.12.4 皮肤保护药

皮肤保护药（skin protector）是通过外用某些物质，阻隔不良环境因素对皮肤的刺激，使皮肤减轻或免受外界物理、化学和生物因素损害的一类产品。广泛用于日常皮肤保健和某些职业病的预防。前述的部分皮肤保湿药、屏障保护药本身也具有一定的皮肤保护功能。

氧化锌滑石粉

Zinc Oxide and Talc Powder

【适应证】预防痱子、间擦疹。

【注意事项】勿用于眼内。不用于有渗出、糜烂处。

【禁忌证】对氧化锌过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 1 ~ 2 次。

复方硼酸粉

Compound Boric Acid Powder

【适应证】预防痱子、间擦疹。

【注意事项】勿用于眼内。不用于有渗出、糜烂处。

【禁忌证】对氧化锌过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 1 ~ 2 次。

痱子粉

Antimiliaria Powder

【适应证】散风祛湿，清凉止痒。用于汗疹、痱毒、湿疮痛痒。

【注意事项】勿用于眼内。不用于有渗出、糜烂处。

【禁忌证】对本品所含成分过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 2 ~ 3 次。

【制剂与规格】小儿痱子粉：每瓶 100 g。

复方月见草油乳膏

Compound Evening Primose Oil Cream

【适应证】保护皮肤。

【注意事项】勿用于眼内。

【禁忌证】对此成分过敏者禁用。

【用法与用量】外用：一日 2 ~ 3 次。

16.13 避光药及防晒药

紫外线根据波长可分为长波紫外线（UVA），中波紫外线（UVB）和短波紫外线（UVC）。大气中对人有影响的主要是能够到达地球表面的 UVB 和 UVA。适当的紫外线照射对人的健康有益，例如可以促进人体合成维生素 D。但过度的照射，可损伤皮肤，急性 UVB 损伤导致表皮细胞坏死，造成晒伤；慢性 UVB 损害可能诱发皮肤癌。而 UVA 主要引起光老化。避光药及防晒药是现代生活中不可缺少的护肤品。常用的避光药大致分为化学性吸收剂和物理性屏蔽剂两大类。化学性吸收剂可选择性吸收紫外线而起到防晒作用，常用的有对氨基苯甲酸、邻氨基苯甲酸酯类、水杨酸酯类、甲氧基肉桂酸酯类、二苯酮及其衍生物、甲烷衍生物、樟脑系列。物理性避光剂指本身不吸收紫外线，但能反射、散射紫外线，从而可以起到物理屏蔽作用。常用的防晒霜中大多含有二氧化钛、氧化锌、高岭土、滑石粉、氧化铁等。其中，二氧化钛或氧化锌对 UVB 的屏蔽作用更强。与化学性避光剂相比，物理性屏蔽产品安全性和稳定性更好，不容易发生光毒或光变态反应。但单独使用物理性防晒产品对 UVA 的防护作用有限。所以，实际使用的防晒产品中，很多是既含有物理性也含有化学性避光剂的复合物。

16.14 性传播疾病用药

16.14.1 梅毒的治疗用药

（1）梅毒（syphilis）是苍白螺旋体引起的一种慢性、全身性的性传播疾病，可分为后天获得性梅毒和胎传梅毒（先天梅毒）。获得性梅毒又分为早期和晚期梅毒。早期梅毒病期在2年以内，包括一期、二期和早期潜伏梅毒。晚期梅毒病期在2年以上，包括晚期良性梅毒、心血管和神经梅毒、晚期潜伏梅毒等。胎传梅毒又分为早期（出生2年内发病）和晚期（出生2年后发病）。梅毒的主要诊断方法是暗视野显微镜检查、非梅毒螺旋体抗原血清学试验和梅毒螺旋体抗原血清学试验。

梅毒的处理原则是及早发现，及时治疗。早期梅毒经充分足量治疗，90%以上可治疗越早，效果越好。治疗后要经过足够时间的追踪观察。对所有性伴侣应同时进行检查和治疗。

治疗梅毒的抗生素主要有：①青霉素类：青霉素是所有类型梅毒的首选和最有效治疗药物，至今尚未见实验室对梅毒螺旋体耐药的报道。只有在青霉素过敏的情况下，才考虑使用其他抗生素。各期梅毒的治疗需选择合适的青霉素剂型，早期梅毒和晚期树胶肿梅毒选用苄星青霉素、普鲁卡因青霉素，神经梅毒及心血管梅毒选用水剂青霉素G。梅毒治疗后可发生吉海（Jarisch-Herxheimer）反应，又称疗后剧增反应，常发生于首剂抗梅毒药物治疗后数小时，并在24小时内消退。全身反应似流感样，包括发热、畏寒、全身不适、头痛、肌肉骨骼痛、恶心、心悸等。此反应常见于早期梅毒，反应时硬下疳可肿胀，二期梅毒疹可加重。在晚期梅毒中发生率虽不高，但反应较严重，特别是在心血管梅毒和神经梅毒患者中可危及生命。为减轻此反应，可于治疗前口服泼尼松，一日30～40 mg，分次给药，抗梅毒治疗后2～4日逐渐停用。此反应还可致妊娠期妇女早产或胎儿宫内窒息，应给予必要的医疗监护和处理，但不应就此不治疗或推迟治疗。②四环素类为青霉素过敏者的替代治疗药物，对梅毒螺旋体的制动能力比青霉素小1 000倍，其疗效不如青霉素。因需要多次用药，患者的依从性是治疗成功与否的关键。主要用四环素、多西环素、大环内酯类作为替代治疗药物其疗效不及青霉素。红霉素的半衰期短，对脑脊液的渗透性差，且有梅毒螺旋体耐药的个案报告；需要多次用药，患者的依从性也较差，用药后应密切随访。治疗对青霉素过敏的妊娠期妇女梅毒，主要用红霉素。

（2）早期梅毒：一期表现为硬下疳，腹股沟或患部近卫淋巴结肿大。不治疗可发展为二期，表现为多形性皮肤黏膜疹、扁平湿疣、全身浅表淋巴结肿大，可发生骨关节、眼、内脏及神经系统损害等。

早期梅毒的治疗可采用普鲁卡因青霉素G一日80万U，肌内注射，一日1次，连续15日；或苄星青霉素G 240万U，分为两侧臀部肌内注射，一周1次，共2～3次。如患者对青霉素过敏，则采用多西环素100 mg，一日2次，连服15日；或盐酸四环素500 mg，一日4次，连服15日（肝、肾功能不全者禁用）；或红霉素500 mg，一日4次，连服15日。二期复发梅毒的治疗采用后述的晚期梅毒治疗方案。

（3）晚期梅毒：病情轻者发生晚期良性梅毒，主要为皮肤黏膜损害。较重者发生心血管梅毒和神经梅毒。

①晚期良性梅毒可采用普鲁卡因青霉素G一日80万U，肌内注射，一日1次，连续20日为1个疗程，也可考虑给第2疗程，疗程间停药2周；或苄星青霉素G 240万U，分为两侧臀部肌内注射，一周1次，共3次。如患者对青霉素过敏，则采用多西环素100 mg，一日2次，连服30日；或盐酸四环素500 mg，一日4次，连服30日（肝、肾功能不全者禁用）；或红霉素500 mg，一日4次，连服30日。

②对于心血管梅毒，如有心力衰竭，首先治疗心力衰竭，待心功能可代偿时，可注射青霉素，但从小剂量开始以避免发生吉海反应，造成病情加剧或死亡。水剂青霉素G，第1日10万U，1次肌内注射；第2日10万U，2次肌内注射；第3日20万U，2次肌内注射；自第4日起按下列方案治疗：普鲁卡因青霉素G，一日80万U，肌内注射，连续15日为1个疗程，总剂量1 200万U，共2个疗程或

更多，疗程间停药2周。不用苄星青霉素G。对青霉素过敏者用以下药物：多西环素100 mg，一日2次，连服30日；或盐酸四环素500 mg，一日4次，连服30日（肝、肾功能不全者禁用）；或红霉素500 mg，一日4次，连服30日。

③对于神经梅毒，推荐采用水剂青霉素G，一日1 800万～2 400万U，静脉滴注300万～400万U，每4小时1次，连续10～14日。继以苄星青霉素，一周240万U，肌内注射，共3次。或普鲁卡因青霉素一日240万U，分次肌内注射，同时口服丙磺舒，一次0.5 g，一日4次，共10～14日。必要时，继以苄星青霉素G，一周240万U，肌内注射，共3次。对青霉素过敏者用以下药物：多西环素100 mg，一日2次，连服30日；或盐酸四环素500 mg，一日4次，连服30日（肝、肾功能不全者禁用）；或红霉素500 mg，一日4次，连服30日。

对于晚期皮肤黏膜、骨、关节梅毒，治疗要求症状消失，防止发生新的损害，不一定要求血清转阴。而对于心血管梅毒、神经梅毒与各种内脏梅毒，在用青霉素治疗前最好结合有关专科进行处理，并慎重地进行抗梅毒治疗，切忌在短时期内用大量抗梅毒药物，以免发生瘢痕收缩引起重要脏器的严重功能障碍。

（4）隐性梅毒（潜伏梅毒）：一般无临床表现。如病期在2年内，称为早期隐性梅毒；病期在2年以上，称为晚期隐性梅毒。早期或晚期隐性梅毒的治疗方案与早期或晚期显性梅毒的方案一致。对不能确定病期的隐性梅毒的治疗一律按晚期隐性梅毒处理。对于隐性病毒，治疗目的主要为预防各种复发，防止病情进展和发生晚期梅毒，早期隐性梅毒争取血清阴转，而对晚期隐性梅毒不要求血清阴转。

（5）胎传梅毒：对于早期胎传梅毒，患儿如有脑脊液异常者，采用水剂青霉素G，一日10万～15万U/kg，出生后7日以内的新生儿，以一次5万U/kg，静脉注射每12小时1次；出生7日以后的婴儿每8小时1次，直至总疗程10～14日。或普鲁卡因青霉素G，一日5万U/kg，肌内注射，一日1次，疗程10～14日。如脑脊液正常，采用苄星青霉素G，5万U/kg，1次分两侧臀肌注射。如无条件检查脑脊液者，可按脑脊液异常者治疗。对于晚期胎传梅毒，推荐采用普鲁卡因青霉素G，一日5万U/kg，肌内注射，连续10日为1个疗程对较大儿童的青霉素用量，不应超过成人同期患者的治疗量。对青霉素过敏者，可用红霉素治疗，一日7.5～12.5 mg/kg，分4次口服，连服30日。8岁以下的儿童禁用四环素。

早期胎传梅毒的治疗要求症状消失，争取血清阴转。当患儿内脏损害多而严重时，首先要立足于挽救患儿的生命，小心谨慎地进行治疗，避免发生严重的吉海反应。而对于晚期胎传梅毒，要求损害愈合及预防新的损害发生，不一定要求血清阴转。

（6）其他治疗和随访注意事项：妊娠期妇女梅毒的治疗方案根据不同的梅毒病期，采取相应的治疗方案。要求在妊娠最初3个月和末3个月各应用1个疗程。对青霉素过敏者建议用红霉素治疗，禁用四环素及多西环素。

梅毒经足量规则治疗后，应定期随访，复查非梅毒螺旋体抗原血清学试验滴度。第1次治疗后隔3个月复查，以后每3个月复查1次，1年后每半年复查1次。共随访2～3年。对血清固定者，如临床上无复发表现，并除外神经、心血管及其他内脏梅毒，可不必再治疗，但要定期复查血清反应滴度，心血管梅毒及神经梅毒需随访3年以上。

16.14.2 淋病的治疗用药

（1）淋病：淋病（gonorrhea）是淋病奈瑟菌（淋球菌）感染所引起的性传播疾病。本病潜伏期短、传染性强，最常见表现为泌尿生殖系统的化脓性炎症。诊断采用脓液涂片染色镜检和淋球菌培养法。

淋病的处理应遵循及时、足量、规则用药的原则。注意多重病原体感染，一般同时应用抗沙眼衣原体药物。性伴侣如有感染应同时接受治疗。治疗后应进行随访。

治疗淋病的抗生素主要有：①头孢菌素类。淋球菌对其敏感性高，药物血浆半衰期长，不良反应小。近年来淋球菌耐药监测未见耐头孢曲松的菌株，但值得注意

的是，随着这类药物在临床应用的增加，淋球菌对其的敏感性有下降的趋势。临床研究发现这类药物的淋病临床治愈率高，对直肠及咽部感染有效，妊娠期安全有效，对治疗新生儿感染也有效。主要用药为第三代头孢菌素如头孢曲松；头孢噻肟及头孢克肟。②氨基糖苷类。大观霉素在临床上仅用于淋病的治疗，近年来的淋球菌耐药监测很少见耐药株。适用于不能耐受头孢菌素的患者。对淋球菌无青霉素交叉耐药性。可用于妊娠期和儿童患者。对咽部淋病无效。

（2）无并发症淋病：男性主要表现为尿道炎，淋菌性包皮龟头炎、后尿道炎等。女性主要为宫颈炎、尿道炎、尿道旁腺炎、前庭大腺炎等。幼女可因间接接触而发生淋菌性外阴阴道炎。

治疗成人推荐抗生素单次疗法，如头孢曲松钠 250 mg，肌内注射；或大观霉素 2 g（宫颈炎 4 g），肌内注射；或头孢噻肟 1 g，肌内注射。口服药物可选用头孢克肟 400 mg，口服，单次给药。其他第三代头孢菌素类，如已证明其疗效较好，亦可选作替代药物。对于儿童淋病，可给予头孢曲松钠 125 mg，肌内注射；或大观霉素 40 mg/kg，肌内注射。

（3）有并发症淋病：男性并发症包括附睾炎、精囊炎、前列腺炎，极少数患者可并发系带旁腺或尿道旁腺炎、尿道球腺炎等。女性并发症多为淋菌性宫颈炎（未及时治疗，淋球菌上行感染而致），表现为淋菌性盆腔炎。

有并发症淋病的治疗与无并发症者相同，但疗程需延长。治疗方案为：头孢曲松钠 250 mg，肌内注射，一日 1 次，共 10 日；或大观霉素 2 g，肌内注射，一日 1 次，共 10 日；或头孢噻肟 1 g，肌内注射，一日 1 次，共 10 日。替代方案可采用头孢克肟 400 mg，口服，一日 1 次，共 10 日。淋菌性盆腔炎的门诊治疗方案可在上述用药的基础上，加甲硝唑 400 mg，口服，一日 2 次，共 14 日。

（4）其他部位淋病：根据淋球菌感染部位的不同，淋病还可表现为新生儿和成人的淋菌性眼炎、淋菌性直肠炎、淋菌性咽炎等。治疗方案与无并发症淋病相似，单剂用药即可。但淋菌性咽炎用大观霉素治疗疗效差。

（5）播散性淋病：极为少见，可出现淋菌性关节炎、败血症等。推荐住院治疗，需检查有无心内膜炎或脑膜炎。如果沙眼衣原体感染不能排除，应加上抗沙眼衣原体感染药物。治疗采用头孢曲松钠 1 ~ 2 g，肌内注射或静脉注射，一日 2 次，共 10 日或以上；或大观霉素 2 g，肌内注射，一日 2 次，共 10 日或以上。淋菌性关节炎者，除髋关节外，不宜施行开放性引流，但可以反复抽吸，禁止关节腔内注射抗生素。淋菌性脑膜炎上述治疗的疗程约 2 周，心内膜炎疗程要 4 周以上。

大观霉素 [保（乙）]

Spectinomycin

【适应证】主要用于奈瑟淋球菌所致的尿道炎、前列腺炎、宫颈炎和直肠感染，以及对青霉素、四环素等耐药菌株引起的感染。由于多数淋病患者同时合并沙眼衣原体感染，因此应用本品治疗后应继续以 7 日疗程的四环素或多西环素或红霉素治疗。

【注意事项】本药对治疗梅毒无效，于短期大量使用抗生素治疗淋病时，可能会掩盖或延迟潜伏性梅毒的症状。故治疗淋病患者时，如认为有梅毒可能时，应每个月做血清学检查，至少 3 个月。过敏体质者慎用。

【禁忌证】对本品及氨基糖苷类抗生素过敏史者及肾病患者禁用。孕妇及新生儿禁用。

【不良反应】注射部位疼痛，荨麻疹，眩晕，恶心，感冒样症状，发热，失眠等，尿量减少，血红蛋白、血细胞比容降低，碱性磷酸酯酶、BUN 及 SGPT 升高。

【用法与用量】本药 2 g 溶于 3 ml 稀释液 0.9% 苯甲醇中。在加人稀释剂后至吸取前应加以摇动。配制后的悬浮液可置于室温 25℃下，但必须在 24 小时以内使用。使用 20 号注射针头为宜，应注射于臀肌上部外侧，深入臀肌中。不得静脉给药。

【制剂与规格】注射粉剂：每瓶 2 g。

16.14.3 泌尿生殖道沙眼衣原体感染的治疗用药

泌尿生殖道沙眼衣原体感染(urogenital chlamydial infections)是常见的性病。在男性，沙眼衣原体常引起尿道炎、附睾炎等，女性常引起宫颈炎、盆腔炎，男女两性均可引起直肠炎、眼结膜炎等。诊断方法包括沙眼衣原体抗原检测、PCR检测和细胞培养等。

生殖道沙眼衣原体感染宜早期诊断，早期治疗。及时、足量、规则用药。性伴侣应该同时接受治疗。治疗后进行随访。

治疗泌尿生殖道沙眼衣原体感染的抗生素主要有：①大环内酯类，阿奇霉素的血浆和组织半衰期长，一次标准剂量口服，在组织中能达到较高的治疗浓度，在炎症部位保持不少于5日，而且只需单次应用。红霉素由于其胃肠道不良反应常常影响患者对治疗的依从性，因此疗效比阿奇霉素差。其他大环内酯类药物如罗红霉素、克拉霉素及交沙霉素等也可用，具有较好的疗效。主要用药有阿奇霉素、红霉素、克拉霉素、罗红霉素。②四环素类，均有较好的疗效。多西环素与四环素相比，优点在于一日服药次数减少，耐受性稍好，半衰期长，即便漏服1次也有效，同等剂量下抗沙眼衣原体的作用更强。米诺环素是第二代半合成的四环素类药物，具有高度的亲脂性和较强的组织穿透性，在泌尿生殖道的浓度高于有效治疗浓度，因而疗效较高。主要用药有四环素、多西环素、米诺环素。③氟喹诺酮类，氧氟沙星、左氧氟沙星、司帕沙星等的疗效与阿奇霉素或多西环素相当。左氧氟沙星为氧氟沙星的左旋体，作用强1倍，而不良反应更少。司帕沙星的半衰期较长，可一日1次给药，故患者依从性相对较好。司帕沙星有光敏现象，给药时应注意。18岁以下者忌用此类药物。但我国分离的淋球菌菌株大多数对喹诺酮类药物耐药。主要用药有氧氟沙星、左氧氟沙星、司帕沙星等。

首选阿奇霉素1g，单剂口服，或多西环素100mg，一日2次，共7～10日。替代治疗可选用下列方案中的任一种：米诺环素100mg，一日2次，共10日；红霉素碱500mg，一日4次，共7～10日；四环素500mg，一日4次，共7～10日；罗红霉素150mg，一日2次，共7～10日；克拉霉素250mg，一日2次，共7～10日；氧氟沙星300mg，一日2次，共7～10日；左氧氟沙星500mg，一日1次，共7～10日；司帕沙星200mg，一日1次，共7～10日。

16.14.4 尖锐湿疣的治疗用药

尖锐湿疣(condyloma acuminatum)是由人乳头瘤病毒HPV引起，是一种常见的性传播疾病。HPV有100余个亚型，尖锐湿疣90%以上是由低危型即HPV 6或11型引起。少数是由高危型即HPV 16或18型等引起，后者有致癌性，与宫颈癌的发病有关。尖锐湿疣的诊断主要依赖于临床表现，必要时可做组织病理学和HPV DNA检测以协助诊断。

治疗以去除疣体为主要目的，但复发率较高，可达30%～50%。同时应对其性伴侣进行检查及治疗。患者治疗和随访期间应避免性行为。任何外用药物治疗都可能发生皮肤黏膜反应包括瘙痒、灼热、糜烂及疼痛。

典型尖锐湿疣皮损为柔软、粉红色、菜花状或乳头状赘生物，大小不等。HPV亚临床感染很常见，其皮肤黏膜表面外观正常，做醋酸白试验可出现阳性。

对于男女两性外生殖器部位单个疣体直径<5mm、团块直径<10mm、疣体数目<15个的患者，一般可自己外用药物治疗。推荐方案为0.5%鬼臼毒素酊或0.15%鬼臼毒素乳膏，外用。替代方案为5%咪喹莫特乳膏，用法见下述。

如在医院内治疗，可采用CO_2等激光、液氮冷冻、高频电、微波治疗或外科手术切除。药物可采用：①80%～90%三氯醋酸或二氯醋酸，在疣损害上涂少量药液，待其干燥，此时见表面形成一层白霜。在治疗时应注意保护周围的正常皮肤和黏膜，如果外用药液量过剩，可敷上滑石粉、碳酸氢钠或液体皂以中和过量、未反应的酸。如有必要，隔1～2周重复1次，最多6次。②复方硝酸溶液，用涂药棒将药液涂于疣体的表面及根部，至疣体变成灰白色或淡黄色为止，如未愈，3～5日

后可再次治疗。对发生在尿道口或反复复发的损害，可采用光动力疗法。

无论是药物治疗或物理治疗，治疗前应先做醋酸白试验，确定病变部位及数目，尽量清除疣体损害，以减少复发。

治疗尖锐湿疣有效的外用药物主要有：①细胞毒类，如鬼臼毒素。②免疫调节剂，如咪喹莫特。③腐蚀剂，如三氯醋酸、二氯醋酸、硝酸。

鬼臼毒素[保(乙)]

Podophyllotoxin

【适应证】男女外生殖器及肛门周围部位的尖锐湿疣。

【注意事项】(1) 本品仅供外用，不可口服。(2) 用药疣体总面积不应超过 $10\ cm^2$，日用药总量不应超过 0.5 ml。用时切勿触及眼睛。严禁药液与健康皮肤长期接触。(3) 应妥善存放，勿让儿童取用。(4) 男性患者在完全治愈前行房事应使用避孕套。避免与其他含鬼臼树脂制剂同时使用。(5) 12 岁以下儿童、老人慎用。

【禁忌证】对本药过敏者、孕妇与哺乳期妇女以及手术后创口未愈合者禁用。

【不良反应】(1) 涂药部位可出现不同程度烧灼感或刺痛感，以及红斑、水肿和糜烂。脱落后局部可出现红斑或浅表糜烂，以上均为常见的局部反应，不必停药。(2) 个别患者局部反应严重，可用消炎、收敛药液冷湿敷或用霜、乳、糊剂处理，可很快显著减轻症状，对于局部出现严重溃疡、水肿、剧烈疼痛者，必要时可停止治疗。

【用法与用量】(1) 涂药前先用消毒、收敛溶液（如高锰酸钾溶液等）清洗患处、擦干。(2) 用特制药签将药液涂于疣体处，涂遍疣体，不需重复并尽量避免药液接触正常皮肤和黏膜。(3) 用药总量勿超过 1 ml，涂药后暴露患处使药液干燥。(4) 一日用药 2 次，连续 3 日，停药观察 4 日为 1 个疗程。如病灶尚有残留可重复 1 个疗程，但最多不超过 3 个疗程。

【制剂与规格】鬼臼毒素酊：① 3 ml：15 mg；② 8 ml ：40 mg；③ 5 ml ：25 mg。

鬼臼毒素软膏：① 5 g：12.5 mg；② 5g：25 mg。

咪喹莫特

Imiquimod

【适应证】成人外生殖器疣和肛周疣/尖锐湿疣。

【注意事项】外用后常出现红斑，若出现糜烂或破损需要暂停用药，由医师处理创面，并决定是否继续用药。用药前后要洗手。用药部位不能包扎。未进行包皮环切的男性治疗包皮下疣时应将包皮翻起，并每天清洗。本品可能会损害避孕套和阴道隔膜，因此不主张同时使用。不适于尿道、阴道内、子宫颈、肛管内尖锐湿疣的治疗。

【禁忌证】对本药过敏者禁用。

【不良反应】以局部刺激作用为主，可有瘙痒、灼痛、红斑、糜烂。偶见色素减退。

【用法与用量】5% 咪喹莫特乳膏，用手指涂药于疣体上，隔日 1 次晚间用药，一周 3 次，用药 6 ~ 10 小时后，以肥皂和水清洗用药部位，疗程不超过 16 周。

【制剂与规格】咪喹莫特乳膏：5%。

三氯醋酸、二氯醋酸、硝酸和复方硝酸溶液（硝酸、醋酸、草酸、乳酸与硝酸铜的复合制剂） 均具有腐蚀作用，用于疣体较小、数目较少尖锐湿疣的治疗，并应注意保护周围皮肤。不能用于较大、多发性以及面积较大的疣体。应在医护人员指导下使用。不良反应为局部刺激、红肿、糜烂等，严重时可发生溃疡。

16.14.5 生殖器疱疹的治疗用药

(1) 生殖器疱疹：生殖器疱疹（genital herpes）是由单纯疱疹病毒 HSV 感染泌尿生殖器及肛门部位皮肤黏膜而引起的性传播疾病，多数由 HSV-2 引起。生殖器疱疹常反复发作。诊断主要依赖于临床表现，必要时可做病毒培养、抗原检测或核酸检测。

治疗包括全身治疗和局部处理两方面。全身治疗主要是抗病毒治疗，局部处理包括清洁创面和防止继发感染。生殖器疱疹很易复发，常给患者带来很大的心理压力，因此，应给予患者医学咨询、社会

心理咨询、药物治疗等综合处理措施。

治疗生殖器疱疹的抗病毒药主要有：①系统性抗病毒药。阿昔洛韦是最常用的抗疱疹病毒药。虽然该药口服吸收差，半衰期短，需要每天多次口服。但该药安全，耐受性好，价格低廉。伐昔洛韦是阿昔洛韦的L-缬氨酸酯，是阿昔洛韦的前体药。口服吸收后在体内转化为阿昔洛韦而发挥抗病毒作用。泛昔洛韦是喷昔洛韦的前体药，口服利用度高，治疗指数高，为有高度选择性的抗疱疹病毒药。②外用抗病毒药。皮损局部，可外用3%阿昔洛韦乳膏、1%喷昔洛韦乳膏、重组人干扰素α-2b凝胶等，但单独局部治疗的疗效远逊于系统性用药。详细请参见9.6。

(2) 原发性生殖器疱疹：第一次感染HSV而出现症状者，临床表现相对明显。治疗采用阿昔洛韦200 mg，口服，一日5次，共7～10日；阿昔洛韦400 mg，口服，一日3次，共7～10日；伐昔洛韦300 mg，口服，一日2次，共7～10日；泛昔洛韦250 mg，口服，一日3次，共7～10日。

(3) 复发性生殖器疱疹：生殖器疱疹常复发，但复发时的皮损数目相对少，病程也较短。发作时可给予抗病毒治疗，最好在出现前驱症状或皮损出现24小时内开始用药。常用的治疗方案为：阿昔洛韦200～400 mg，口服，一日5次，或伐昔洛韦300～500 mg，口服，一日2次，或泛昔洛韦125～250 mg，口服，一日3次，疗程均为5～7日。对于频繁复发（每年复发≥6次）者，可采用长期抑制疗法。阿昔洛韦400 mg，口服，一日2次；或伐昔洛韦300～500 mg，口服，一日1次；或泛昔洛韦125～250 mg，口服，一日2次。疗程一般为4个月。

第17章 麻醉用药

17.1 全身麻醉及其用药

在全身麻醉期间往往同时给予几种不同类型的药物使手术患者意识消失、无痛苦、肌肉松弛和内环境稳定。麻醉诱导既可通过吸入挥发性麻醉药实现，也可以通过静脉给药实现；麻醉维持可使用静脉麻醉药或吸入麻醉药，还会用到麻醉性镇痛药和骨骼肌松弛药。同时给予吸入麻醉药、静脉麻醉药和麻醉性镇痛药以及具有中枢神经系统抑制作用的药物，会延长彼此的作用时间并增强作用强度。

注意事项如下。

（1）上述药物仅限于有经验的工作人员并在有适当的复苏设备的地方使用。

（2）如果患者术前已使用镇静药或麻醉性镇痛药，麻醉诱导时所使用的药物可能需要减量。

（3）对患者伴随疾病应加强治疗，应达到术前准备的要求。

（4）手术和患者长期用药的处理：术前停用长期用药导致疾病失控的风险常常远高于手术期持续用药的风险，因此麻醉科医师需了解患者正在服用的所有药物，了解这些药物的药理特性和与麻醉药可能出现的相关作用，对于是否术前停药应做出正确的决策。①持续用糖皮质激素6个月以上患者，术前不应停药，否则可能发生血压的剧烈下降，同时在麻醉期间及术后应即刻提供糖皮质激素的保护。②正在使用阿司匹林或其他抗凝药的患者，围术期渗血的风险增加。为此，麻醉科医师应与外科医师分析相对危险性，并共同决定是否应用抗凝药或用肝素替代治疗。③心血管用药（抗高血压药和治疗冠心病用药）、抗癫痫药、抗帕金森病药、抗焦虑药、支气管扩张药、青光眼用药、免疫抑制药、甲状腺激素及抗甲状腺药物术前不宜停用。三环类抗抑郁药无须术前停药，但与血管活性药物可发生危险的相互作用导致心律失常及高血压的风险增高。④糖尿病患者停用口服降糖药，根据患者血糖水平给予胰岛素，并及时调整输注胰岛素剂量。⑤术前停用口服避孕药。单胺氧化酶抑制剂类（MAOI）药物可能与血管活性药物发生危险的相互作用，应在术前2周停药。根据治疗医师意见决定雌激素替代治疗是否术前停用。如果抗抑郁药物需术前停药，则需逐渐减量，以防出现戒断症状。应在大手术前24小时停用锂盐。应在术晨停用保钾利尿药，防止术中因为肾脏灌注不良或组织受损时引起高钾血症。

17.1.1 静脉麻醉及其用药

经静脉给予药物产生全身麻醉状态为静脉麻醉，静脉麻醉药既可用于麻醉诱导，也可用于手术时麻醉的维持。使用时必须有一定的复苏设备。一般患者接受日常手术，多选用硫喷妥钠或丙泊酚诱导，老年、

衰弱或休克患者选用依托咪酯或氯胺酮诱导，心脏手术患者选用小量静脉麻醉药（依托咪酯、咪达唑仑或丙泊酚）和大剂量麻醉性镇痛药诱导。该类药物的个体差异显著，推荐剂量仅作为参考。老年人、体弱或休克患者需减少药物用量。

全凭静脉麻醉：该技术指在手术时使用的所有麻醉药均由静脉给药。既可维持自主呼吸，也可施行机械通气。肌肉松弛药可用于提供良好的肌肉松弛和预防反射性肌肉运动。需注意的主要问题是麻醉深度的评价。靶控输注（TCI）系统可用于滴定静脉麻醉药给予的剂量并提示成人患者的血浆药物浓度。

静脉麻醉药作用特点如下。

硫喷妥钠，属于巴比妥类药物。使用广泛，但并无止痛作用。诱导快速平稳，但可发生剂量依赖性的呼吸和循环抑制。使用中等剂量的硫喷妥钠苏醒迅速，是由于该药可快速再分布于体内其他组织，尤其是脂肪组织。该药代谢缓慢，反复给药时有蓄积作用，可导致苏醒延迟。

依托咪酯，是一种苏醒迅速无宿醉感的麻醉诱导用药。给药后不引起心率和血压的变化。不自主肌肉运动发生率较高，但可通过诱导前给予麻醉性镇痛药或短效苯二氮䓬类药物降低其发生率。注射疼痛可通过经由较大静脉给药或诱导前给予麻醉性镇痛药缓解。依托咪酯可抑制肾上腺皮质功能，尤其是持续给药时，因此用于麻醉维持，特别是给予重症感染的患者应慎重。

丙泊酚，具有苏醒迅速且无宿醉感的特点，即使持续给药无明显蓄积作用，停药后苏醒迅速，苏醒质量较高，因此在临床被广泛使用。静脉注射时可能产生注射部位疼痛，并可引起明显的不自主肌肉活动。丙泊酚可引起心动过缓，血压下降，给予剂量较大、注药速度过快、低血容量和心血管功能受损患者尤为明显。

氯胺酮，在亚麻醉剂量有较好的镇痛作用。给予后较少引起血压下降。常用于儿科手术的麻醉诱导和维持；苏醒相对较慢，并可引起不自主的肌肉运动。氯胺酮的主要缺点是可引起幻觉、噩梦和其他暂时性的精神症状，但可通过给予地西泮或咪达唑仑等药物减轻其发生。氯胺酮连续使用可产生依赖性，在我国按第一类精神药品管理。

硫喷妥钠[保（甲）]

Thiopental Sodium

【适应证】静脉全麻药。主要用于全麻诱导，复合全麻及儿童基础麻醉。另可用于终止癫痫持续状态。

【注意事项】(1) 与巴比妥类药存在着交叉过敏，对其他巴比妥类药过敏者，也可对本品过敏。(2) 肝功能不全慎用。(3) 本品能通过胎盘屏障，静脉注射后2～3分钟，脐静脉血中即可检出该药，可抑制胎儿的中枢神经，分娩或剖宫产时应谨慎使用。(4) 本品可少量泌入乳汁，哺乳期妇女慎用。(5) 老年患者应减量。(6) 婴幼儿慎用。(7) 心血管疾病、肾上腺皮质及甲状腺功能不全患者慎用。(8) 溶解后药液呈强碱性，一旦外渗可引起组织坏死和剧烈疼痛；避免动脉内注射。(9) 用药时需注意监测呼吸和循环功能，如呼吸深度和频率、脉搏血氧饱和度、血压、脉搏、心律、心电图等。(10) 本品能减少碘 ^{123}I 或 ^{131}I 的吸收。

【禁忌证】(1) 怀疑有潜在性卟啉病的患者。(2) 心力衰竭、肝肾功能严重不全、糖尿病、低血压、高钾血症、严重贫血、严重酸中毒、休克、呼吸困难、气道堵塞和哮喘患者。(3) 咽喉手术患者。(4) 新生儿。(5) 对本品或巴比妥类药过敏者。

【不良反应】静脉注射过快或反复多次给药可导致血压下降和呼吸抑制，少见心律失常、心肌抑制、喉痉挛、过敏性反应、皮疹、注射部位刺激性等。有少数患者（0.3%～5%）会出现不寻常的反应，如神志不清、兴奋、幻觉、颜面和口唇或眼睑肿胀、瘙痒、皮疹、颤抖、呼吸困难，甚至出现心律失常。

【用法与用量】临用前用注射用水溶解成2.5%～5%溶液。(1) 全麻诱导：成人，常用量按体重4～8 mg/kg静脉注射，应先用小剂量（0.5～1 mg/kg），证明患者无特殊反应，才注入足量，耐受性较大者则用量可酌增。老年人应减量至2～2.5 mg/kg。(2) 基础麻醉：儿童，

肌内注射一次按体重5～10 mg/kg。极量，静脉或肌内注射，儿童肌内注射一次20 mg/kg。(3) 中止癫痫持续状态（仅在其他方法无效时）2.5%（25 mg/ml）溶液静脉注射，单次给药75～125 mg，必要时重复。

【制剂与规格】注射用硫喷妥钠：① 0.5 g；② 1 g。

羟丁酸钠[保（乙）]

Sodium Hydroxybutyrate

【适应证】用于复合全麻的诱导和维持，常与全麻药或麻醉辅助药合用。

【注意事项】(1) 注射15分钟后可出现血清钾一过性下降，对于低钾血症患者应纠正后方能使用，在术中应监测心电图，如有U波出现，应及时处理。(2) 快速、大剂量静脉注射可引起心率减慢，有传导阻滞的患者及心率低于每分钟50次的患者慎用。(3) 孕妇及哺乳期妇女用药尚不明确。

【禁忌证】严重低钾血症。

【不良反应】(1) 麻醉诱导与苏醒过程中可引起锥体外系症状。(2) 用药后呼吸分泌物增加。(3) 本品能抑制呼吸，出现呼吸频率减慢。

【用法与用量】静脉注射：(1) 常用量：①全麻诱导：一次60～80 mg/kg，注射速度每分钟约1 g。小儿最高按体重100 mg/kg。成人诱导量2～5 g，手术时间长者每隔1～2小时追加1～2 g。②全麻维持：一次12～80 mg/kg。③基础麻醉：成人用量为50～60 mg/kg，小儿为60～80 mg/kg。(2) 极量：成人一次总量按体重300 mg/kg。

【制剂与规格】羟丁酸钠注射液：10 ml：2.5 g。

依托咪酯[保（乙）]

Etomidate

【适应证】适用于全麻诱导，也可用于短时手术麻醉维持。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女慎用本品。(2) 哺乳妇女应终止哺乳。(3) 10岁以上儿童按照成人剂量应用。10岁以下按医嘱用药。6个月以内新生儿和婴幼儿不宜使用。(4) 老年人用量酌减。(5) 大剂量静脉滴注依托咪酯可抑制肾上腺皮质对促肾上腺素的应激反应，中毒性休克、多发性创伤或肾上腺皮质功能减退者，应同时给予适量的氢化可的松。(6) 因无镇痛作用，用于麻醉诱导或短期麻醉维持时须同时给予麻醉性镇痛药。(7) 本品不宜稀释使用，也不能与其他注射液混合注射。

【禁忌证】对本品或脂肪乳过敏者、重症糖尿病、高钾血症患者。

【不良反应】可抑制肾上腺皮质功能。常见恶心、呕吐及注药后不自主的肌肉活动。有时会出现咳嗽，呃逆和寒战。

【用法与用量】缓慢静脉注射按体重一次0.15～0.3 mg/kg（相当于0.075～0.15 ml/kg依托咪酯脂肪乳注射液），于30～60秒注射完毕。

【制剂与规格】依托咪酯脂肪乳注射液：10 ml：20 mg。

氯胺酮[基（基），保（甲）]

Ketamine

【适应证】用于各种表浅、短小手术麻醉、不合作小儿的诊断性检查麻醉及全身复合麻醉。

【注意事项】(1) 本品可使妊娠子宫的压力及收缩强度与频率增加，同时本品可迅速通过胎盘屏障，使胎儿肌张力增加。孕妇慎用。(2) 本品是唯一具有镇痛作用的静脉全麻药。颅内压增高、脑出血、青光眼患者不宜单独使用。(3) 静脉注射速度切忌过快，否则易致一过性呼吸暂停。(4) 苏醒期间可出现噩梦、幻觉，预先应用镇静药，如苯二氮䓬类，可减少此反应。(5) 完全清醒后心理恢复正常需一定时间，24小时内不得驾车和操作精密性工作。(6) 重度休克患者或心功能不全者可引起血压剧降，甚至心搏骤停。

【禁忌证】顽固、难治性高血压、严重的心血管疾病及甲状腺功能亢进患者。

【不良反应】(1) 麻醉恢复期可出现幻觉、躁动不安、噩梦及谵语等，一般青壮年易出现且严重。(2) 术中常有泪液、唾液分泌增多，血压、颅压及眼压升高。不能自控的肌肉收缩偶见。(3) 偶有呼吸抑制或暂停及喉痉挛，多半是在用量较大、

分泌物增多时发生。

【用法与用量】(1) 全麻诱导和维持：成人，静脉注射，按体重 1 ~ 2mg/kg，维持可采用连续静脉滴注，每分钟不超过 1 ~ 2 mg，即按体重 10 ~ 30μg/kg，加用苯二氮䓬类药，可减少其用量。(2) 镇痛：成人，先按体重静脉注射 0.2 ~ 0.75 mg/kg，2 ~ 3 分钟注完，而后连续静脉滴注每分钟按体重 5 ~ 20μg/kg。(3) 基础麻醉：临床个体间差异大，儿童肌内注射按体重 4 ~ 5 mg/kg，必要时追加 1/3 ~ 1/2 量。

【制剂与规格】盐酸氯胺酮注射液：① 2 ml : 100 mg； ② 10 ml : 100 mg； ③ 20 ml : 200 mg。

丙泊酚[保(甲)]

Propofol

【适应证】全身麻醉诱导和维持。重症监护患者辅助通气治疗时的镇静。无痛苦有创检查。

【注意事项】(1) 本品含大豆油，极少数患者可能出现严重的过敏反应。(2) 本品可少量地通过乳汁分泌，故哺乳期妇女应在使用本品后 24 小时内停止哺乳。(3) 脂肪代谢紊乱，心脏、呼吸系统、肝肾疾病患者，癫痫及癫痫发作者慎用。(4) 心血管或呼吸功能不全及低血容量患者应于使用本品前予以纠正。(5) 可考虑在诱导前或麻醉维持期间静脉注射抗胆碱药，尤其是迷走神经张力有可能占优势或本品与其他可能引起心动过缓的药物合用时。(6) 有脂肪代谢障碍及在 ICU 持续给药 3 日后的患者应监测脂质情况。(7) 只有在特别注意且严密监测下，本品才可用于失代偿性心力衰竭患者和其他严重心肌疾病的患者。(8) 病态肥胖患者应特别注意因剂量偏大导致的血流动力学方面的剧烈变化。(9) 伴有高颅压和低平均动脉压的患者，使用本品时有降低脑灌注压的危险，应特别小心。(10) 为减轻注射位点的疼痛，可在用本品前注射利多卡因。(11) 持续用药超过 1 日时，丙泊酚的用量不宜超过按体重计每小时 4 mg/kg。

【禁忌证】对丙泊酚及其赋形剂过敏者、妊娠期妇女及产科患者（流产者除外）。不用于 1 个月以下小儿的全身麻醉及重症监护小婴儿的镇静。

【不良反应】多见诱导期局部疼痛；常见低血压、面部潮红、心动过缓、诱导期一过性呼吸暂停；少见血栓形成及静脉炎；偶见诱导过程中肌阵挛，发生率 1% 左右；罕见惊厥和角弓反张的癫痫样运动；偶见横纹肌溶解、胰腺炎、术后发热、延长给药后尿液变色、血管水肿及支气管痉挛等症状、性欲亢进、肺水肿。

【用法与用量】连续应用不得超过 7 日。用法：①静脉输注本品可以不用稀释，也可用 5% 葡萄糖或 0.9% 氯化钠注射液稀释后装于玻璃输液瓶内滴注。②严格无菌操作，12 小时内用完。③原液使用时必须使用输液泵等设备，以控制输注速度。稀释本品的输注亦应采用适当的控制技术，避免用量过大给药速度过快。用量：①成人麻醉：麻醉诱导，缓慢静脉注射每 10 秒 20 ~ 40 mg 直到起效。大多数 < 55 岁的成人诱导剂量为 1.5 ~ 2.5 mg/kg。55 岁以上者需要量一般下降为 2 mg/kg。ASA Ⅲ - Ⅳ患者，特别是心功能不全的患者，重症患者，应严格控制给药剂量和速度，每 10 秒不超过 20 mg。麻醉维持，静脉输注每小时 4 ~ 12 mg/kg，在应激小的手术过程中，如小手术，可将剂量减至每小时 4 mg/kg，或依据反应重复单次静脉注射 25 ~ 50 mg。对于老年人、一般状态不稳定或低血容量及 ASA Ⅲ - Ⅳ患者，建议维持剂量减至按体重每小时 4 mg/kg。②儿童麻醉：由于缺乏经验，1 个月以下的小儿不应使用本品。麻醉诱导，8 岁以上的儿童麻醉诱导时，通常剂量约为 2.5 mg/kg。8 岁以下者需要量可以更大，初始剂量 3 mg/kg，必要时可按 1 mg/kg 的剂量追加。由于缺少临床经验，对于高危（ASA Ⅲ - Ⅳ）年幼患者，建议应用更低的剂量。麻醉维持，建议每小时 9 ~ 15 mg/kg。< 3 岁的儿童可采用略高的用药剂量，但剂量范围应在上述建议范围内。麻醉的最长时间一般不超过 60 分钟左右。③重症监护成人患者的镇静：连续静脉输注，按体重计每小时 0.3 ~ 4.0 mg/kg 的剂量给药，给药速度不能超过按体重计每小时 4 mg/kg。根据

镇静的深度需要调整剂量。

【制剂与规格】丙泊酚乳剂注射液：① 20 ml ∶ 200 mg；② 20 ml ∶ 400 mg；③ 50 ml ∶ 500 mg；④ 100 ml ∶ 1g。

17.1.2 吸入麻醉及其用药

吸入性麻醉药可能是气态或挥发性液态，经呼吸道吸入后，产生全身麻醉作用，可用于静脉麻醉诱导后维持麻醉。有的吸入麻醉药（七氟烷）也可用于全身麻醉的诱导。

气态麻醉药（氧化亚氮）需要一定装置（金属气瓶）保存和给药，挥发性液态麻醉药（异氟烷、七氟烷和地氟烷），通过特定的挥发器，以空气、氧气或氧化亚氮 - 氧气混合气为载体，经呼吸道进入患者体内。吸入麻醉药均可引起恶性高热，禁用于恶性高热易感者。为避免患者缺氧，必须保证吸入氧浓度 > 30%。卤族吸入麻醉药可延长非去极化骨骼肌松弛药的肌松作用。

异氟烷[保(甲)]

Isoflurane

【适应证】各年龄患者吸入性全身麻醉诱导及维持。

【注意事项】(1) 颅内压增高者慎用。(2) 由于中到重度上呼吸道不良事件发生率较高，故不建议对儿童用本品麻醉诱导，但可用于麻醉维持。(3) 老年人维持浓度应酌减，并加用其他药物。(4) 使用本品麻醉的深度极易发生变化，应使用专用挥发器以精确设定及控制药物输出。(5) 本品对呼吸有抑制作用，故术前用药应视患者具体情况而定。一般多选用抗胆碱药。(6) 有刺激性气味，单纯吸入诱导时可使患者咳嗽或屏气。(7) 冠心病患者避免使用高浓度。在使用时须注意“冠状动脉窃血”现象，特别是心内膜下心肌缺血的患者，使用本品后降低血压作用更为敏感。(8) 在用药过程中，保持心律稳定的同时，必须密切监视患者的自主呼吸，必要时须辅助呼吸。

【禁忌证】已知对异氟烷或其他卤素麻醉剂过敏者、恶性高热易感者、全身麻醉的有关禁忌证。

【不良反应】(1) 高浓度可使正常冠状动脉扩张，引起“心肌窃血”。(2) 深麻醉下可出现低血压和呼吸抑制。(3) 术后可出现寒战、恶心和呕吐、分泌物增加等，还可出现房性心律失常和室性心律失常。(4) 高浓度时能使子宫肌松弛，并使宫缩药减效，产妇分娩时应慎用。(5) 偶见恶性高热。(6) 罕见脑电图改变和伴发惊厥。极少引起肝功能损害。

【用法与用量】应使用异氟烷专用挥发器。异氟烷的最小肺泡气浓度（MAC）随年龄而改变。不同年龄组的MAC平均值，见表17-1。(1) 全麻诱导：建议起始吸入浓度为0.5%，逐渐增加至1.5% ~ 3.0%的浓度下7 ~ 10分钟达到手术麻醉。(2) 全麻维持：在氧 / 70%氧化亚氮混合气中导入1.0% ~ 2.5%的异氟烷浓度可维持合适的外科麻醉。当氧化亚氮浓度较低时，或仅与氧气或氧气 / 空气混合气体配用时，则本品浓度应增加0.5% ~ 1.0%。

表 17-1 不同年龄组的 MAC 平均值

年 龄	纯氧中的平均 MAC 值
12 个月以前	1.6% ~ 1.85%
1 ~ 5 岁	1.50% ~ 1.60%
25 岁左右	1.25% ~ 1.30%
45 岁左右	1.10% ~ 1.20%
65 岁左右	1.00% ~ 1.10%

【制剂与规格】异氟烷吸入用液体剂：100 ml/ 瓶。

恩氟烷[保(甲)]

Enflurane

【适应证】本品作用比乙醚弱，一般用于复合全身麻醉，可与多种静脉全身麻醉药和全身麻醉辅助用药联合应用。

【注意事项】(1) 吸入全麻期间忌做过度通气，以免在苏醒过程中出现中枢兴奋或惊厥。(2) 术后有恶心症状，在少数病人全麻后会出现中枢兴奋。在脑电图上偶见癫 样波。(3) 病人如患有肾病则有可能增加肾毒性的危险性。

【禁忌证】①对本品或氟烷类麻醉药过敏者。②有严重心肺功能不全，肝肾功

能损害、癫痫发作及颅内压高患者。③恶性高热或已知为恶性高热的遗传性易感者。④孕妇及哺乳期妇女。

【不良反应】(1) 使用恩氟烷麻醉过深时，尤其伴有过度通气时，可引起以肌张力过高为特点的强直性肌痉挛。(2) 以恩氟烷进行诱导时，报道过有低血压和呼吸抑制的发生，在开始手术刺激后自行消失。(3) 清醒时恶心呕吐的发生率与恩氟烷之间的相关性比与其他大多数麻醉药的相关性均弱。(4) 偶见呃逆和呕吐的发生。(5) 有些患者在使用恩氟烷后偶见血糖轻度增高，所以糖尿病患者应慎用。(6) 极少病例出现一过性心律失常。

【用法与用量】吸入给药：①全麻诱导，吸气浓度，一般成人开始 0.5%，逐渐增至 3%，以 4.5% 为极限。②维持麻醉，一般情况用 0.5%～3%的浓度。

【制剂与规格】恩氟烷液体：250 ml。

七氟烷[保(乙)]

Sevoflurane

【适应证】用于成人和患儿全身麻醉的诱导和维持。

【注意事项】(1) 肝胆疾患及肾功能低下者慎用。(2) 妊娠期妇女（妊娠 3 个月内)，只有明确需要才可使用本品；哺乳期妇女慎用。(3) 本品可引起子宫肌松弛，产科麻醉时慎用。(4) 对于有颅压升高危险的患者应慎用，并联合应用降低颅压的方法，如过度换气。(5) 本品麻醉的苏醒期通常较短，需较早给于镇痛药以减轻手术后疼痛。

【禁忌证】已知对七氟烷过敏的患者、已知或怀疑有恶性高热遗传史的患者。

【不良反应】(1) 常见：恶心和呕吐；成人，低血压；老年人，低血压和心动过缓；儿童，激动不安和咳嗽加重。(2) 可见：兴奋、嗜睡、寒战、心动过缓、头晕、唾液增多、呼吸紊乱、高血压、心动过速、喉痉挛、发热、头痛、体温降低、ALT 增高。(3) 偶见：心律不齐、LDH 增高、AST 增高、低氧血症、呼吸暂停、白细胞增多、室性期前收缩、室上性期前收缩、哮喘、精神错乱、肌酐增高、尿潴留、糖尿、心房颤动、完全性房室传导阻滞、二联律、白细胞减少。(4) 极少见恶性高热、急性肾衰竭、肺水肿。

【用法与用量】(1) 七氟烷应通过经特殊校准过的挥发器来使用，以便能准确地控制其吸入浓度。(2) 年龄对七氟烷的 MAC 的影响（表 17-2)。(3) 诱导：剂量须个体化，并须依据患者的年龄和临床状况来调整。七氟烷可与纯氧或氧－氧化亚氮同时使用完成麻醉诱导。①成人，七氟烷吸入浓度至 5%，2 分钟内通常可达到外科麻醉效果；②儿童：七氟烷吸入浓度至 7%，2 分钟内即可达到外科麻醉效果。作为术前没有用药的患者的麻醉诱导，七氟烷吸入浓度为 8%。(4) 维持：七氟烷伴或不伴氧化亚氮维持麻醉的浓度为 0.5%～3%。老年患者通常用较低的七氟烷浓度即可维持外科麻醉。(5) 苏醒：七氟烷麻醉的苏醒期通常较短。因此，患者会较早要求给予镇痛药减轻手术疼痛。

表 17-2 年龄对七氟烷的 MAC 的影响

患者年龄（岁）	七氟烷在氧气中 MAC	七氟烷在 65%N_2O/35%O_2 中的 MAC
<3	3.3%～2.6%	2.0%
3～5	2.5%	/
5～12	2.4%	/
25	2.5%	1.4%
35	2.2%	1.2%
40	2.05%	1.1%
50	1.8%	0.98%
60	1.6%	0.87%
80	1.4%	0.70%

儿科患者使用 60%N_2O/40%O_2

【制剂与规格】七氟烷吸入用液体剂：① 120 ml/ 瓶；② 250 ml/ 瓶。

地氟烷[保(乙)]

Desflurane

【适应证】吸入性麻醉药，主要用于成人、婴儿及儿童的全麻维持。但不推荐用于小儿的麻醉诱导。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女应权衡利弊方可使用。(2) 不宜用于哺乳期妇女。(3) 颅内压持续升高者、重症肌无力者慎用。(4) 老年人心血管抑制明显，应慎用。(5) 对于有冠心病或不希望有心率加快和血压增高的患者，本品不应作为唯一的麻醉诱导药，最好与其他静脉药物合并使用，如静脉给予阿片类和催眠药。冠状动脉疾病的患者，为避免心肌缺血，应维持正常的血流动力学。(6) 本品因沸点低(23.5℃)，不能用标准蒸发器，需用电子温控蒸发器，使温度保持在 23 ~ 25℃。

【禁忌证】对含氟吸入麻醉药过敏者、有恶性高热家族史或怀疑有恶性高热病者、有服用氟类麻醉药后发生肝功能损害者、不明原因的发热者禁用。不推荐用于产科手术及神经外科手术。

【不良反应】可致剂量依赖性血压下降和呼吸抑制，麻醉诱导时可出现咳嗽、屏气、分泌物增多、呼吸暂停、喉痉挛和肝功能可有暂时性、可逆性异常。浓度迅速增加时可引起心率增快、血压升高，对高血压和冠心病患者不利。对易感者可导致恶性高热。术后可有恶心和呕吐。

【用法与用量】吸入给药，需用专用蒸发器（表 17-3）。(1) 全麻诱导：①引起下颌松弛、完成气管插管：单用本品浓度为 12% ~ 15%。也可配合应用静脉麻醉药或氧化亚氮等；②外科麻醉：如术前用过阿片类药，则本品常用起始浓度为 3%，每隔 2 ~ 3 次呼吸增加 0.5% ~ 1% 的浓度，当吸入浓度达到 4% ~ 11% 后，2 ~ 4 分钟可达到麻醉效果；③用静脉麻醉药诱导后，无论携带的气体是氧气还是氧化亚氮，本品的起始浓度均为 0.5 ~ 1MAC。(2) 全麻维持：①同氧化亚氮混合吸入，2% ~ 6% 浓度可维持在外科麻醉期水平；②同氧气或空气 / 氧气混合吸入，则需 2.5% ~ 8.5% 浓度；③单药吸入，需 5.2% ~ 10% 浓度；④尽管短时间应用本品的浓度可达 18%，但如果同氧化亚氮混合高浓度吸入，应确保吸入氧浓度不低于 25%。若需要进一步的肌肉松弛，可加用肌肉松弛药。(3) 慢性肝肾功能损害及肾移植者一般无须调整剂量，当用本品与氧化亚氮 / 氧气混合吸入时，本品的浓度为 1% ~ 4%。

【制剂与规格】地氟烷吸入用液体剂：① 240 ml/ 瓶；② 250 ml/ 瓶。

氧化亚氮[保(乙)]

Nitrous Oxide

【适应证】单独使用麻醉效果不理想，与吸入麻醉药、静脉麻醉药、麻醉性镇痛药、骨骼肌松弛药、镇静药等合用，组成全身复合麻醉。也可用于无痛分娩与镇痛。

【注意事项】(1) 氧化亚氮须与氧同时使用，要有准确的氧化亚氮和氧的流量表，且经麻醉机给予氧化亚氮时，麻醉机须具有抗氧装置，氧浓度应在 30% 以上才安全。(2) 长时间给予氧化亚氮应避免高浓度。(3) 应有完善的麻醉废气排除系统，以减少氧化亚氮对手术室工作人员的不良影响。(4) 停止吸入本品时必须给氧 5 分钟左右，以防“弥散性缺氧”。

表 17-3　年龄对地氟烷的最低肺泡有效浓度（MAC）的影响

患者年龄（岁）	在 100% 氧中的 MAC	在 60% 氧化亚氮 /40% 氧中的 MAC
0 ~ 1	8.95% ~ 10.65%	5.75% ~ 7.75%*
1 ~ 12	7.20% ~ 9.40%	5.75% ~ 7.00%**
18 ~ 30	6.35% ~ 7.25%	3.75% ~ 4.25%
30 ~ 65	5.75% ~ 6.25%	1.75% ~ 3.25%
>65	NA···	NA···

*3 ~ 12 个月；**1 ~ 5 岁；NA···　尚缺乏资料

【禁忌证】体内存在气囊肿、肠梗阻及肠胀气、气胸、气脑、高头位开颅手术者禁用。

【不良反应】(1) 高浓度、长时间吸入后可抑制维生素 B_{12} 的合成，引起巨幼红细胞性贫血，抑制白细胞形成。(2) 本品高浓度吸入(>80%)有引起缺氧的危险。

【用法与用量】成人吸入给药，必须配备有准确精密的麻醉机，有浮旋量气标测定每分钟氧和氧化亚氮气流量。全麻诱导时，吸入浓度可达 70%。麻醉诱导先采用高流量，当吸入浓度与肺泡浓度达平衡后，再减低流量。给予低流量吸氧期间，应严密监测吸入氧的浓度。全麻维持时，吸入浓度为 50% ~ 70%,应严防供氧不足。

【制剂与规格】氧化亚氮：在 50 个大气压下呈液态贮存在耐压钢瓶内。

17.2 麻醉辅助用药

麻醉过程中除静脉、吸入及局部麻醉用药外，还有辅助麻醉用药：(1) 抗毒蕈碱类药：减少腺体分泌，保持呼吸道通畅，解除或减轻内脏牵拉反应。(2) 肌肉松弛药：全麻诱导时便于气管插管和术中保持良好的肌肉松弛。(3) 胆碱酯酶抑制药：我国使用的仅为新斯的明，拮抗非去极化肌松药的残留肌松作用。(4) 镇静药：减轻患者的恐惧与焦虑。(5) 镇痛药：阿片类镇痛药主要用于术中和术后引起的疼痛及应激反应。非阿片类镇痛药为阿片类术后镇痛药的有效替代药。(6) 中枢和呼吸抑制拮抗药：纳洛酮拮抗阿片类镇痛药导致的呼吸抑制。氟马西尼用于拮抗苯二氮䓬类药引起的中枢神经系统镇静作用。(7) 围术期治疗用液体：用于维持手术患者循环容量电解质和酸碱状态稳定。

17.2.1 抗毒蕈碱药

抗毒蕈碱药（目前已较少使用）作为手术前用药可以减少由气管插管、上呼吸道手术和部分吸入麻醉药引起的支气管腺体及唾液分泌。还可在使用新斯的明前或同时使用，以预防心动过缓、唾液分泌过多和其他给予新斯的明引起的毒蕈碱样作用。还可用于预防丙泊酚和琥珀胆碱等药物引起的心动过缓和低血压。

硫酸阿托品现已很少用作成人术前用药，但还经常作为迷走神经张力增高时的抢救用药。与新斯的明同时给予，可用于逆转非去极化肌松药的残留作用。

东莨菪碱可减少腺体分泌，同时还有一定的遗忘、镇静和抗呕吐作用。与阿托品不同的是，它可引起心动过缓，而不是心动过速。在部分患者，尤其是老年人，东莨菪碱可引起中枢抗胆碱能综合征（躁动、共济失调、幻觉、行为改变及困倦）。

阿托品[保(甲)] 用于全身麻醉前给药、严重盗汗和流涎症。用法：(1) 麻醉前用药：①成人，术前 0.5 ~ 1 小时，肌内注射 0.5 mg。②儿童，皮下注射体重 3 kg 以下者为 0.1 mg，7 ~ 9 kg 为 0.2 mg，12 ~ 16 kg 为 0.3 mg，20 ~ 27 kg 为 0.4 mg，32 kg 以上为 0.5 mg。(2) 拮抗毒蕈碱样作用，静脉注射新斯的明 0.04 ~ 0.07 mg/kg，同时给予阿托品 0.02 ~ 0.035 mg/kg。(其他见 3.1.4.1)

东莨菪碱[保(乙)]

Scopolamine

【适应证】用于麻醉前给药、减少腺体分泌、震颤麻痹、晕动症、躁狂性精神病、胃肠胆肾平滑肌痉挛、胃酸分泌过多、感染性休克、有机磷中毒。

【注意事项】(1) 肠梗阻、重症肌无力、癫痫、前列腺肥大和老年人慎用。(2) 皮下注射或肌内注射时要注意避开神经与血管，如需反复注射，不宜在同一部位，应左右交替注射，另外，静脉注射速度不宜过快。(3) 对老年人用药，应注意监测呼吸及意识情况。

【禁忌证】对本品过敏者、青光眼、严重心脏病、器质性幽门狭窄或麻痹性肠阻者。

【不良反应】常见口干、眩晕、皮肤潮红、灼热、兴奋、烦躁、谵妄、惊厥、心率加快，严重时可见瞳孔扩大。

【用法与剂量】皮下注射或肌内注射：于术前用药，一次 0.3 ~ 0.5 mg，极量一日 1.5 mg，于麻醉诱导前 30 ~ 60 分钟给药。儿童 15μg/kg 或麻醉诱导前即

刻静脉注射。

【制剂与规格】氢溴酸东莨菪碱注射液：① 1 ml：0.3 mg；② 1ml：0.5 mg。

（其他见 3.5.1）

戊乙奎醚[保（乙）]

Penehyclidine

【适应证】(1) 麻醉前给药以抑制涎腺和气道腺体分泌。(2) 用于有机磷农药中毒急救治疗和中毒后期或胆碱酯酶（ChE）老化后维持阿托品化。

【注意事项】(1) 本品对心脏（胆碱能 M_2 受体）无明显作用，故对心率无明显影响。(2) 当用本品治疗有机磷农药中毒时，不能以心率加快来判断是否“阿托品化”，而应以口干和出汗消失或皮肤干燥等症状判断“阿托品化”。(3) 因可抑制呼吸道腺体分泌，故对严重的呼吸道感染伴痰少、黏稠者慎用。(4) 心率不低于正常值时，一般不需联合应用阿托品。(5) 本品血浆消除半衰期较长，每次用药间隔时间不宜过短，剂量不宜过大。(6) 本品对前列腺增生的老年患者可加重排尿困难症状，用药时应严密观察。

【禁忌证】青光眼患者禁用。

【不良反应】常见口干、面部潮红和皮肤干燥等。如用量过大，可出现头晕、尿潴留、谵妄和体温升高等。一般不需特殊处理，停药后可自行缓解。

【用法与用量】肌内注射：(1) 麻醉前用药，术前 0.5 小时，成人用量 0.5 ~ 1 mg。(2) 救治有机磷毒物（农药）中毒，根据中毒程度选用首次用量。轻度中毒 1～2 mg，必要时配伍用氯解磷定 500～750 mg。中度中毒 2 ~ 4 mg，同时配伍用氯解磷定 750～1 500 mg。重度中毒 4～6 mg，同时配伍用氯解磷定 1 500 ~ 2 500 mg。首次用药 45 分钟后，如仅有恶心、呕吐、出汗、流涎等毒蕈碱样症状时只应用盐酸戊乙奎醚 1 ~ 2 mg；仅有肌颤、肌无力等烟碱样症状或 ChE 活力低于 50% 时只应用氯解磷定 1 000 mg，无氯解磷定时可用解磷定代替。如上述症状均有时重复应用盐酸戊乙奎醚和氯解磷定的首次半量 1 ~ 2 次。中毒后期或 ChE 老化后可用盐酸戊乙奎醚 1 ~ 2 mg，维持“阿托品化”，每次间隔 8 ~ 12 小时。本品与其他抗胆碱药（阿托品、东莨菪碱和山莨菪碱等）配伍用时有协同作用，应酌情减量。

【制剂与规格】盐酸戊乙奎醚注射液：1 ml：1 mg。

17.2.2 肌肉松弛药

麻醉中使用的骨骼肌松弛药是神经-肌肉传导阻滞药，它们不同于治疗骨骼肌病变时给予作用于脊髓或脑的肌肉松弛药。麻醉中给予骨骼肌松弛药可以避免不必要的过深麻醉，确保腹肌和膈肌松弛，利于完成气管内插管和手术操作。

对接受骨骼肌松弛药的患者，必须施行辅助呼吸和控制呼吸，直到患者自主呼吸恢复满意，以保证患者通气正常；同时须给予足够的吸入麻醉药或静脉麻醉药，预防患者术中知晓。手术结束时，应注意给予肌松拮抗药即胆碱酯酶抑制药逆转骨骼肌松弛药的残留肌松作用。

骨骼肌松弛药根据作用机制被分为去极化和非去极化骨骼肌松弛药，去极化骨骼肌松弛药是琥珀胆碱；非去极化骨骼肌松弛药有阿曲库铵、顺阿曲库铵、维库溴铵、罗库溴铵和哌库溴铵等。去极化骨骼肌松弛药引起神经肌肉结合部运动终板短暂持续去极化，使运动终板失去对乙酰胆碱的反应性，产生肌肉松弛。肌松出现前，因肌纤维非协同收缩，会出现肌颤，且去极化骨骼肌松弛药产生的神经-肌肉传导阻滞对四个成串刺激的反应不出现衰减。非去极化骨骼肌松弛药与乙酰胆碱竞争，占据运动终板上胆碱能受体的乙酰胆碱结合部，使乙酰胆碱不再能够和其受体结合，产生肌肉松弛，非去极化骨骼肌松弛药产生的神经肌肉传导阻滞对 4 个成串刺激呈现衰减效应，胆碱酯酶抑制药能够逆转非去极化骨骼肌松弛药的残留肌松作用。

琥珀胆碱因起效快，作用时间短，通常用于急症快速插管和困难插管，罗库溴铵起效快，可用于快速插管和术中维持肌肉松弛。顺阿曲库铵适用于肝肾功能障碍的重症和急症患者，多次重复给予后不会出现蓄积作用。哌库溴铵是长效骨骼肌松弛药，适用于长时间需要肌肉松弛的手术

和术后需要呼吸机治疗的重症患者。

阿曲库铵[保(甲)]

Atracurium

【适应证】适用于各种外科手术中全身麻醉期间的骨骼肌松弛，也适用于气管插管时所需的肌肉松弛。

【注意事项】(1) 妊娠妇女应慎用或酌情减量。(2) 下列情况慎用：神经肌肉接头疾病如重症肌无力及电解质紊乱者。(3) 一次剂量不宜过大，因可致肌张力增高。(4) 溶解后立即使用或置冰箱保存，否则药效下降。(5) 本品尤适于肝肾功能不全、黄疸患者、嗜铬细胞瘤手术和门诊手术。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】快速大剂量静脉注射时可引起低血压、心动过速、支气管痉挛、一过性皮肤潮红等。

【用法与用量】注射用阿曲库铵，使用前用注射用水 5 ml 溶解，立即使用。(1) 成人，静脉注射 0.3 ~ 0.6 mg/kg，可维持肌肉松弛 15 ~ 25 分钟，需要时可追加剂量 0.1 ~ 0.2 mg/kg，延长肌松时间。(2) 1 岁以上儿童剂量与成人相同。(3) 老人与呼吸、肝肾功能差的患者亦可用标准剂量或酌情减量。

【制剂与规格】苯磺酸阿曲库铵注射液：① 2.5 ml : 25 mg；② 5 ml : 50 mg。

注射用阿曲库铵：① 25 mg；② 50 mg。

顺阿曲库铵[保(乙)]

Cisatracurium

【适应证】本品作为全麻或在重症监护病房（ICU）治疗中辅助用药。它可以松弛骨骼肌，使气管插管和机械通气易于进行。

【注意事项】(1) 顺阿曲库铵能使呼吸肌和其他骨骼肌瘫痪，而对意识和痛觉没有影响。(2) 对于其他神经肌肉阻滞药过敏的患者在使用本品时应引起高度重视，因为有报道存在神经肌肉阻滞药的交叉反应。(3) 顺阿曲库铵对心率无明显影响，亦不能拮抗由多种麻醉药或术中因刺激迷走神经而引起的心动过缓。(4) 重症肌无力及其他形式的神经肌肉疾病患者使用本品的推荐起始剂量为不大于 0.02 mg/kg。(5) 严重的酸碱失调和（或）血浆电解质紊乱可增加或降低对神经肌肉阻滞药的敏感性。(6) 本品不可与丙泊酚注射乳剂或碱性溶液（如硫喷妥钠）在同一注射器中混合或用同一针头同时注射。(7) 本品是阿曲库铵单一顺式结构的化合物，比阿曲库铵作用更强，作用时间略长于阿曲库铵。本品无组胺释放作用，无心血管系统不良反应。

【禁忌证】对阿曲库铵及顺阿曲库铵过敏者、妊娠期妇女。

【不良反应】可见皮肤潮红或皮疹、心动过缓、低血压和支气管痉挛。极少数情况下，当本品与一种或多种麻醉药合用时，有严重过敏反应的报道。偶见重症监护病房的严重疾病患者在过长时间使用肌肉松弛剂后出现肌无力和（或）肌病。

【用法与用量】(1) 静脉单次给药。①成人静脉单次注射给药：行气管插管 0.15 mg/kg 或遵医嘱。用丙泊酚诱导麻醉后，按此剂量给予本品，120 秒后即可达到良好至极佳的插管条件。②成人维持用药：对以阿片类或丙泊酚麻醉的患者，给予 0.03 mg/kg 的本品可继续产生大约 20 分钟临床有效的神经 - 肌肉阻滞作用，连续使用维持剂量不会导致神经 - 肌肉阻滞作用的持续延长。③成人自然恢复：神经 - 肌肉阻滞自然恢复速度与给药量无关，当使用阿片类或丙泊酚进行麻醉时，颤搐反应从 25% ~ 75% 及 5% ~ 95% 恢复的平均时间分别为 13 和 30 分钟。④成人拮抗：给予标准剂量胆碱酯酶抑制药可以很容易地拮抗本品的神经肌肉阻滞作用；⑤ 2 ~ 12 岁儿童：给药剂量为 0.1 mg/kg，并在 5 ~ 10 秒内进行，给药后 2 分钟内即可插管；⑥儿童维持用药：以氟烷麻醉时，给予 0.02 mg/kg 的药量，可以继续维持约 9 分钟临床有效的神经肌肉阻滞。(2) 静脉输注给药：①成人和 2 ~ 12 岁儿童：以每分钟 3μg/kg（每小时 0.18 mg/kg）的速度输注，一旦达到稳定状态后，大部分患者只需要以每分钟 1 ~ 2μg/kg（每小时 0.06 ~ 0.12 mg/kg）的速度连续输注即可维持阻滞作用。但当采用异氟烷或恩氟烷麻醉时，本品的输注速率可减

少高达40%；②肾功能损害患者的剂量与肾功正常的患者类似，仅起效时间稍慢；③肝脏功能损害患者的剂量：晚期肝病患者无须调整用药剂量，此类患者的药效动力学特点与肝功正常的患者类似，但起效时间稍快；④成年ICU患者推荐的起始输注速度为每分钟3μg/kg（每小时0.18 mg/kg）（表17-4，表17-5）。

表17-4 2 mg/ml的顺阿曲库铵注射液的输注速度（每小时ml数）

患者体重(kg)	剂量（每分钟μg/kg）			
	1.0	1.5	2.0	3.0
20	0.6	0.9	1.2	1.8
70	2.1	3.2	4.2	6.3
100	3.0	4.5	6.0	9.0

表17-5 5 mg/ml的顺阿曲库铵注射液的输注速度（每小时ml数）

患者体重(kg)	剂量（每分钟μg/kg）			
	1.0	1.5	2.0	3.0
70	0.8	1.2	1.7	2.5
100	1.2	1.8	2.4	3.6

【制剂与规格】顺阿曲库铵注射液：①2.5ml : 5mg；②5ml : 10 mg；③10ml : 20mg；④20ml : 40mg；⑤ 30ml : 150 mg。

维库溴铵[保（甲）]

Vecuronium Bromide

【适应证】本品主要用于辅助全身麻醉，易化气管插管及手术中松弛肌肉。

【注意事项】(1) 本品用于肾衰竭患者时，药物的起效时间和恢复时间可能会略有延长，(2) 妊娠期妇女经医师权衡利弊后才可使用。(3) 乳汁中是否会含有本品还不清楚。(4) 下列情况慎用：肝硬化、胆汁淤积或严重肾功能不全者可延长肌松持续时间和作用消退时间。(5) 本品在用于患有神经肌肉疾病或曾经患有儿童麻痹症的患者时应慎重，需缓慢滴注直至出现反应为止。重症肌无力应慎用。(6) 剖宫产手术的剂量不应超过0.1 mg/kg。(7) 心血管疾病、高龄、水肿等导致分布容量增大，均可能会使神经肌肉阻滞药的起效时间延长。(8) 由于个体差异，有些患者可能需要使用较高的剂量，只要维持合适的机械通气，无论是用氟烷麻醉还是采用神经安定镇痛麻醉，首次剂量可为0.15 ~ 0.3 mg/kg，而无心血管不良反应。(9) 肥胖患者，应根据患者的实际体重计算给药剂量。(10) 烧伤者对非去极化肌松药具有一定的耐受性。因此建议缓慢滴注药物直至出现反应为止。(11) 因妊娠毒血症使用硫酸镁治疗患者，能增加维库溴铵的神经-肌肉阻断效应，应减少本品用量，并根据颤搐反应慎重给药。(12) 吸入麻醉药能强化其作用。使用吸入麻醉药时应减少本品的用量。(13) 配制或稀释后所得液体在室温(15 ~ 25℃)、日光下可保存24小时，如不能保证绝对严格的无菌操作，液体保存不得超过12小时（15 ~ 25℃）。

【禁忌证】对本品或溴离子有过敏史者。

【不良反应】罕见过敏反应。

【用法与用量】本品仅供静脉注射使用。①插管剂量：0.08 ~ 0.12 mg/kg。②维持剂量：0.02 ~ 0.03 mg/kg，最好在颤搐反应恢复到对照值的25%时再追加维持剂量。③与其他神经-肌肉阻断药一样，其用量应随患者而异，应使用末梢神经刺激器监测神经肌肉传导阻滞及恢复程度。④新生儿和婴儿首次剂量0.01 ~ 0.02 mg/kg即可，如颤搐反应未抑制到90% ~ 95%，可再追加剂量。在临床手术中，用药剂量不应超过0.1 mg/kg。5个月至1岁的婴幼儿所需剂量与成人相似。儿童维持剂量应酌减。⑤持续静脉滴注时的剂量，应先给予单剂量（0.08 ~ 0.1 mg/kg），等神经肌肉阻滞开始恢复时，再开始静脉滴注，滴速调节到维持到颤搐反应在对照值的10%为宜。一般认为滴速为每分钟0.8 ~ 1.4μg/kg。新生儿和婴儿参照上述内容。本品溶剂：①本品可用下列注射液溶解成1 mg/ml浓度，灭菌注射用水、5%葡萄糖注射液、0.9%氯化钠注射液、乳酸复方氯化钠注射液、葡萄糖氯化钠注射液。②稀释剂：本品用灭菌注射用水溶解后，可用下列注射液混合稀释40 mg/L浓度供用，0.9%氯化钠

注射液、5% 葡萄糖注射液、复方氯化钠注射液液、葡萄糖复方氯化钠注射液。

【制剂与规格】维库溴铵注射液：2 ml ∶ 4 mg。

泮库溴铵[保(乙)]

Pancuronium Bromide

【适应证】用于气管插管、术中肌肉松弛维持。

【注意事项】(1) 本品必须在有经验的医师监护下使用。(2) 本品可引起呼吸肌松弛，应给病人使用机械呼吸，直至自主呼吸恢复为止。(3) 本品使用过程中，变态反应的发生率不高，但应密切注意，并采用相应的防范准备和措施。(4) 妊娠毒血症患者用硫酸镁治疗时，可加强神经肌肉阻断作用，此时使用该药，用量要减少。(5) 梗阻性黄疸病人、神经肌肉性疾病（肌病、严重肥胖、脊髓灰质炎史者等）患者应慎用。(6) 具有高血压倾向者如嗜铬细胞瘤患者或肾脏疾病引起的高血压应慎用。(7) 电解质紊乱（低血钾、高血镁、低血钙等）、pH 改变及脱水时慎用，上述情况的出现要求在必要时预先加以纠正。(8) 采取低温技术实施手术时，神经肌肉阻断作用下降。相反，当恢复正常体温时，神经肌肉阻断作用恢复正常。(9) 本品不能与其他药物或溶液混合使用。(10) 泮库溴铵注射液打开后应及时使用，使用后之剩余药液应该丢弃。(11) 孕妇分娩时慎用，孕妇及哺乳期妇女用安全性尚未确立，医师应权衡对妊娠患者的利弊，决定是否应用。

【禁忌证】(1) 对本品及溴离子过敏史者、严重肝肾功能不全和重症肌无力患者禁用。(2) 高血压、心动过速及心肌缺血时应避免使用。

【不良反应】(1) 可产生心血管作用，如心率略增快，平均动脉血压和心输出量略增加。(2) 极少数患者可发生变态反应和组胺释放。(3) 在麻醉过程中有时出现流涎，特别是术前未使用抗胆碱能药物时。(4) 可使正常及升高的眼压明显下降（±20%）达数分钟，也会产生缩瞳。

【用法与用量】(1) 用法：①泮库溴铵注射液仅供静脉注射用；可用 0.9% 氯化钠注射液、5% 葡萄糖注射液、乳酸钠林格溶液稀释或混合。②本品用量与个体差异、麻醉方法、手术持续时间及同其他药物的相互作用有关；为控制神经肌肉阻断作用和恢复，建议使用外周神经刺激器。③肥胖患者应考虑身体净重而酌减剂量。④由于吸入性麻醉剂会增强本品作用，当使用这类麻醉药时，应减少本品用量。(2) 用量：①成人常用量：气管插管时肌松，0.08 ~ 0.10 mg/kg，3 ~ 5 分钟内可作气管插管。琥珀酰胆碱插管后（琥珀酰胆碱的临床作用消失后）及手术之初剂量 0.06 ~ 0.08 mg/kg。肌肉松弛维持剂量 0.02 ~ 0.03 mg/kg。②临床研究显示，儿童所需剂量与成人剂量相当，4 周以内新生儿对非去极化阻断剂特别敏感，剂量应降低，建议先试用初剂量 0.01 ~ 0.02 mg/kg，而后依情况而定。

【制剂与规格】泮库溴铵注射液：① 2 ml ∶ 4 mg；② 5 ml ∶ 10 mg；③ 10 ml ∶ 10 mg。

罗库溴铵[保(乙)]

Rocuronium Bromide

【适应证】罗库溴铵为全身麻醉辅助用药，用于全麻诱导期间气管插管，以及维持术中肌松。

【注意事项】(1) 本品可引起呼吸肌麻痹，故使用此药的患者必须采用人工呼吸支持，直至患者的自主呼吸充分恢复。(2) 罗库溴铵剂量超过每千克体重 0.9 mg 时，有可能增加心率。(3) 在重症监护病房（ICU）中长期应用肌松药，为了避免本品可能引起的肌松作用延长，应注意监测神经肌肉传递功能。(4) 低血钾、高镁血症、低钙血症、低蛋白血症、脱水、酸中毒、高碳酸血症及恶病质等情况可增强罗库溴铵的作用，用药时应适当减量。(5) 重症肌无力、严重肝肾功能不全者慎用。(6) 其余同维库溴铵"注意事项"(1)、(2)、(4)、(6)、(9)、(10)。

【禁忌证】对罗库溴铵或溴离子有过敏反应者。

【不良反应】有轻微组胺释放作用，但临床无心率及血压变化，但应注意可能在注射部位发生瘙痒和红斑和（或）发生

全身类过敏反应。大剂量时有对抗迷走神经的作用，可能引起心率加快。

【用法与用量】(1) 气管插管：常规麻醉中本品的标准插管剂量为0.6 mg/kg，60秒内在几乎所有患者中可提供满意的插管条件。(2) 维持剂量：0.15 mg/kg，在长时间吸入麻醉患者可适当减少至0.075 ~ 0.1 mg/kg，最好在肌肉颤搐反应恢复至对照值的25%或对4个成串刺激具有2 ~ 3个反应时给予维持剂量。(3) 连续输注推荐：静注0.6 mg/kg后，当肌松开始恢复时再行连续输注。适当调整输注速率，使肌肉颤搐反应维持在对照的10%或维持于对4个成串刺激保持1 ~ 2个反应。(4) 在成人静脉麻醉下：维持该水平肌松时的滴注速率范围为每分钟5～10μg/kg，吸入麻醉下每分钟5 ~ 6μg/kg。(5) 老年患者、肝脏和（或）胆道疾病和（或）肾衰竭患者：在常规麻醉期间气管插管的标准剂量0.6 mg/kg；无论采取何种麻醉方法，推荐用于这些患者的维持剂量均为0.075 ~ 0.1 mg/kg，滴注速率为每分钟5 ~ 6μg/kg。(6) 超重和肥胖患者（指患者体重超过标准体重30%或更重者）：应适当减少剂量。(7) 氟烷麻醉下，儿童（1～14岁）和婴儿（1～12个月）对罗库溴铵的敏感性与成人相似，但起效较成人快，其临床作用时间儿童较成人短。

【制剂与规格】罗库溴铵注射液：① 2.5 ml ：25 mg；② 5 ml ：50 mg；③ 10 ml ：100 mg；④ 25 ml ：250 mg。

哌库溴铵[保(乙)]

Pipecuronium Bromide

【适应证】用于全身麻醉过程中肌肉松弛，多用于时间较长的手术（60分钟以上）的麻醉。

【注意事项】(1) 仅在利大于弊时，本品才可用于肝病患者。(2) 肾衰竭患者用本品后药效持续时间和作用消退时间可能会延长。(3) 权衡利弊后方可决定妊娠患者是否应用本品。对接受硫酸镁治疗的妊娠高血压综合征患者不宜用本品。(4) 神经肌肉疾病患者慎用。(5) 儿科手术合用地西泮、氯胺酮、芬太尼等麻醉时，儿童用量建议为0.08～0.09 mg/kg体重；新生儿用量建议为0.05 ~ 0.06 mg/kg。以上剂量在外科手术中临床时效为35 ~ 45 min，必要时追加初始剂量的1/3，可延长25 ~ 35分钟的肌松效应。由于个体差异大，建议使用外周神经刺激器检测肌松情况。必要时可使用新斯的明或阿托品拮抗肌松作用。(6) 电解质紊乱、血pH改变、脱水、体温过低可以延长本品作用时间。(7) 低血钾、洋地黄中毒、利尿治疗、高镁血症、低钙血症（输血）、低蛋白血症、脱水、酸中毒、高碳酸血症和恶病质亦可加强或延长本品作用。(8) 本品可以缩短部分凝血活酶时间和凝血酶原时间。

【禁忌证】重症肌无力及对哌库溴铵或溴离子过敏者。

【不良反应】偶见过敏反应。肾功能不全时其消除时间延长。本品不引起组胺释放。

【用法与用量】首次剂量应静脉注射，随后分次静脉注射维持剂量以维持肌肉松弛作用。(1) 需要中度或较长时间手术的成年患者行气管插管时静脉给予0.08 ~ 0.1 mg/kg。(2) 肾功能不全患者，推荐剂量一般不超过0.04 mg/kg。(3) 在重复给药时，重复剂量为最初剂量的1/4 ~ 1/3。

【制剂与规格】注射用哌库溴铵：4 mg（附带专用溶剂2 ml 0.9%氯化钠溶液）。

琥珀胆碱

Succinylcholine

【适应证】去极化型骨骼肌松弛药。可用于全身麻醉时气管插管和术中维持肌松。

【注意事项】(1) 妊娠期妇女慎用。(2) 下列情况慎用，如严重肝功能不全、营养不良、晚期癌症、严重贫血、年老体弱、严重电解质紊乱等患者、使用抗胆碱酯酶药者。(3) 不具备控制或辅助呼吸条件时，严禁使用。(4) 忌在患者清醒下给药。(5) 接触有机农药患者，已证明无血浆胆碱酯酶减少或抑制者，方能使用至足量。(6) 为了解除本品肌松作用引起的短暂纤维颤动，可预先静脉注射小剂量非去

极化肌松药（维库溴铵0.5mg）。(7) 预先给予阿托品可防止本品对心脏的作用。(8) 出现长时间呼吸停止，必须用人工呼吸，亦可输血，注射新鲜冷冻血浆或其他拟胆碱酯酶药，但不可用新斯的明。

【禁忌证】恶性高热、脑出血、青光眼、视网膜剥离、白内障摘除术、低血浆胆碱酯酶、严重创伤大面积烧伤、上运动神经元损伤的患者及高钾血症患者。

【不良反应】(1) 高钾血症：本品引起肌肉纤维去极化时使细胞内 K^+ 迅速流至细胞外，致正常人血钾上升 0.2 ~ 0.5 mmol/L；而严重烧伤、软组织损伤、腹腔内感染、破伤风、截瘫及偏瘫等，在本品作用下引起异常的大量 K^+ 外流致高血钾症，产生严重室性心律失常甚至心脏停搏。(2) 心脏作用：本品的拟乙酰胆碱作用可引起心动过缓、结性心律失常和心脏停搏，尤其是重复大剂量给药最易发生。(3) 眼内压升高：本品对眼外肌引起痉挛性收缩以致眼压升高。(4) 胃内压升高：最高可达 40 cmH_2O，并可引起饱胃患者胃内容反流误吸。(5) 恶性高热：多见于本品与氟烷合用的患者，也多发生于儿童。(6) 术后肌痛：给药后卧床休息者，肌痛少而轻；而 1 ~ 2 日即起床活动者，肌痛多而剧烈。(7) 可能导致肌张力增强：以胸大肌最为明显，其次是腹肌和咬肌，严重时波及肱二头肌和股四头肌等。这时不仅机体总的氧耗量增加，还足以引起胃内压甚至颅内压升高。

【用法与用量】(1) 气管插管：成人 1 ~ 1.5 mg/kg，最高 2 mg/kg；儿童，1 ~ 2 mg/kg，用氯化钠注射液稀释到每 ml 含 10 mg，静脉或深部肌内注射，肌内注射一次不可超过 150 mg。(2) 维持肌松：一次 150 ~ 300 mg 溶于 500 ml 5% ~ 10% 葡萄糖注射液中或 1% 盐酸普鲁卡因注射液混合溶液中，静脉滴注。

【制剂与规格】氯化琥珀胆碱注射液：① 1 ml : 50 mg；② 2 ml : 100 mg。

17.2.3 胆碱酯酶抑制药

胆碱酯酶抑制药可逆性抑制乙酰胆碱酯酶水解乙酰胆碱。神经肌肉结合部乙酰胆碱数量增多，遵循质量作用定律，将从烟碱样胆碱能受体置换出非去极化骨骼肌松弛药，使神经肌肉传导功能恢复正常，非去极化骨骼肌松弛药的作用终止。

乙酰胆碱数量增多后，不仅作用于运动终板的烟碱样乙酰胆碱受体，同时还作用于毒蕈碱样乙酰胆碱受体，引起心动过缓、腺体分泌增加、肠蠕动增强等不良反应。因此，使用胆碱酯酶抑制药拮抗残留肌松作用时，必须同时给予毒蕈碱样乙酰胆碱受体拮抗药。

我国临床麻醉中使用的胆碱酯酶抑制药，仅为新斯的明，在国外还有依酚氯铵(Edrophonium)。

新斯的明 [基(基)，保(甲)]

Neostigmine

【适应证】用于手术结束时拮抗非去极化骨骼肌松弛药的残留肌松作用，用于重症肌无力，手术后功能性肠胀气及尿潴留等。

【注意事项】(1) 以下情况慎用，甲状腺功能亢进和帕金森病等。(2) 拮抗非去极化骨骼肌松弛药时须与阿托品同时使用。

【禁忌证】过敏体质者，癫痫、心绞痛、室性心动过速、机械性肠梗阻或泌尿道梗阻及哮喘患者，心律失常、窦性心动过缓、低血压、迷走神经张力升高者。

【不良反应】本品可致药疹，大剂量时可引起恶心、呕吐、腹泻、流泪、流涎等，严重时可出现共济失调、惊厥、昏迷、言语不清、焦虑不安、恐惧甚至心脏停搏。

【用法与用量】(1) 拮抗肌松残留作用：静脉注射 0.04 ~ 0.07 mg/kg，同时给予阿托品 0.02 ~ 0.035 mg/kg。(2) 重症肌无力患者常用量：皮下注射或肌内注射一次 0.25 ~ 1 mg，一日 1 ~ 3 次。极量，皮下或肌内注射一次 1 mg，一日 5 mg。(3) 治疗手术后逼尿肌无力尿潴留：肌内或皮下注射，成人一次 0.25 mg，每 4 ~ 6 小时 1 次，持续 2 ~ 3 日。(4) 治疗手术后腹胀：成人一次量可增至 0.5 mg，并定时重复给药，随时准备阿托品 0.5 ~ 1 mg 静脉或肌内注射，防治心动过缓，阿托品可先用或同用。(5) 口服，常用量，一次 15 mg（1 片），一日 3 次，重症肌

无力的患者用量视病情而定；极量，一次 30 mg，一日 100 mg。

【制剂与规格】甲硫酸新斯的明注射液：①1 ml：0.25 mg；②1 ml：0.5 mg；③2 ml：1 mg。

溴新斯的明片：15 mg。

依酚氯铵[保(乙)]

Edrophonium Chloride

【适应证】用于骨骼肌松弛药的对抗药及重症肌无力的诊断药，诊断重症肌无力和鉴别肌无力危象及胆碱能危象，也用于筒箭毒碱等非去极化肌松药的拮抗药。

【注重事项】除无溴剂过敏引起的皮疹外，其他基本同溴新斯的明。支气管哮喘及心脏病患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】可有涎液增加、支气管痉挛、心动过缓、心律失常等反应；其他见溴新斯的明。

【用法与用量】①依酚氯铵试验：静脉注射 10 mg，注射后重症肌无力症状明显缓解，维持 10 分钟后又恢复原状，即能确定诊断。②肌无力危象和胆碱能危象的鉴别：先注射 2 mg，若症状好转，再将其余 8 mg 注射完，诊断为肌无力危象；若注射 2 mg 后症状加重，应立即停止注射，诊断为胆碱能危象。③用于筒箭毒碱等非去极化肌松弛剂的拮抗：静脉注射，一次 5 ~ 10 mg，30 ~ 45 秒无效时可重复，总量可达 40 mg。④对抗肌松弛：肌内注射，一次 10 mg。

【制剂与规格】依酚氯铵注射剂：① 1 ml：10 mg；② 2 ml：20 mg；③ 10 ml：100 mg。

17.2.4 围手术期镇静用药

在手术前（包括手术前夜）给予这些药物可减轻患者的恐惧与焦虑，在手术时可以减轻疼痛和增强随后应用的麻醉药的效果。还有一些药物用于提供一定程度的术前遗忘作用。可依据患者个体、手术性质、使用的麻醉药和其他情况如门诊手术、产科、复苏等选择用药。常规手术和急诊手术的用药选择也不尽相同。

（1）儿童术前用药：如果可能，应首选口服给药，但并非能达到满意效果；特殊情况下可经直肠给药。

在注射部位应用局部麻醉药可有效缓解疼痛。

抗焦虑药（苯二氮䓬类药）广泛地被用作术前用药。

（2）苯二氮䓬类药物：苯二氮䓬类药具有抗焦虑、镇静和遗忘作用，适合作为术前用药。口服短效的苯二氮䓬类药是最常用的术前给药方法。此类药物还可用于重症监护病房患者的镇静，尤其是需要辅助通气的患者。

苯二氮䓬类药有时可致显著的呼吸抑制，因此需要相关的治疗设备；避免应用于重症肌无力患者，尤其是在围手术期。

咪达唑仑[保(甲)] 是水溶性的苯二氮䓬类药，静脉给药时可优先选择；其作用消退快于地西泮。静脉大剂量应用或与某些其他药物合用时，咪达唑仑可产生深度镇静作用。本品注射速度宜缓慢，剂量应根据临床需要、患者生理状态、年龄和配伍用药物情况而定。

地西泮[基(基)，保(甲)] 可产生轻度镇静和遗忘作用。为长效药物，且代谢物具有活性，因此在给药后数小时可产生再次催眠作用。但并不推荐儿童围术期常规使用，其药效和起效时间不确定，且可产生反常作用。鉴于地西泮难溶于水，常用为有机溶剂，静脉注射时可致疼痛，并增加静脉血栓发生概率（在注射后几日内仍不易察觉）。地西泮肌内注射有疼痛，且吸收不稳定。静脉注射用的乳剂刺激性较小，且几乎不增加静脉血栓发生概率，但不适用于肌内注射。地西泮也可经直肠给药，但并不是用于术前给药或镇静。静脉注射可用于全麻的诱导和麻醉前给药。用法：①成人静脉注射或肌内注射用于静脉麻醉或基础全麻剂量为 10 ~ 20 mg。②老年人应使用最小有效剂量，缓慢增量，以减少头晕、共济失调及过度镇静等反应。（其他见 1.12）

劳拉西泮[保(乙)] 可产生更长的镇静作用，并具有显著的遗忘作用。它常用作大手术

前夜的术前给药，手术当日清晨若手术开始延迟则可能需补充小剂量或者在手术当日清晨第1次给药。用于镇静及遗忘，术前用药。用法：口服，成人，给药抗焦虑剂量为一次1～2 mg，一日2～3次；镇静催眠剂量为睡前2 mg。(其他见1.14)

咪达唑仑[保(甲)]

Midazolam

【适应证】麻醉前给药，全麻醉诱导和维持，椎管内麻醉及局部麻醉时辅助用药，诊断或治疗性操作（如心血管造影、心律转复、支气管镜检查、消化道内镜检查等）患者镇静，ICU患者镇静。

【注意事项】(1) 慢性肾竭衰、肝功能损害者慎用。(2) 本品不能用于孕妇。在分娩过程中应用须特别注意，单次大剂量注射可致新生儿呼吸抑制，肌张力减退，体温下降以及吸吮无力。(3) 本品可随乳汁分泌，通常不用于哺乳期妇女。(4) 以下情况慎用：体质衰弱者或慢性病、肺阻塞性疾病，或充血性心力衰竭患者，若使用咪达唑仑应减小剂量并进行生命体征的监测。(5) 大剂量用作全麻诱导术后常有较长时间再睡眠现象，应注意保持患者的气道通畅。(6) 本品不能用6%葡聚糖注射液或碱性注射液稀释或混合。(7) 长期静脉注射咪达唑仑，突然撤药可引起戒断综合征，推荐逐渐减少剂量。(8) 肌内注射或静脉注射咪达唑仑后至少3个小时不能离开医院或诊室，之后应有人伴随才能离开。至少12个小时内不得开车或操作机器等。(9) 急性酒精中毒时，与之合用将抑制生命体征。①患者可出现昏迷或休克，低血压的作用将延长；②充血性心力衰竭可延长$t_{1/2}$时间，增加分布容积2～3倍；③出现肝功能损害。(10) 老年人危险性的手术和斜视，白内障切除的手术中，可推荐应用咪达唑仑，但可能会有意识朦胧或定向障碍。

【禁忌证】对苯二氮䓬类药过敏者、重症肌无力患者、精神分裂症患者、严重抑郁状态患者。

【不良反应】(1) 麻醉或外科手术时常见的不良反应为降低潮气量和呼吸频率，发生率为10.8%～23.3%；静脉注射后，有15%的患者可发生呼吸抑制。严重的呼吸抑制易见于老年人，特别是长期用药的老年人，可表现为呼吸暂停，窒息，心跳停搏，甚至死亡。(2) 咪达唑仑静脉注射，特别当与阿片类镇痛剂合用时，可发生呼吸抑制，甚至呼吸停止，有些患者可因缺氧性脑病而死亡。(3) 长期用作镇静后，患者可发生精神运动障碍。亦可出现肌肉颤动，躯体不能控制的运动或跳动，罕见的兴奋，不能安静等。当出现这些症状时应当处理。较常见的不良反应有：①低血压，静脉注射的发生率约为1%；②急性谵妄、朦胧、失定向、幻觉、焦虑、神经质或腿不安宁等。此外还有心率加快且心律不齐、静脉炎、皮肤红肿、皮疹、过度换气、呼吸急促等。③肌内注射局部硬块、疼痛；静脉注射后，静脉触痛等。较少见的症状有：视物模糊、轻度头痛、头晕、咳嗽、飘飘然；手脚无力、麻、痛或针刺样感等。

【用法与用量】(1) 注射：肌内注射时用0.9%氯化钠注射液稀释。静脉给药时用0.9%氯化钠注射液、5%或10%葡萄糖注射液、5%果糖注射液、复方氯化钠注射液液稀释。(2) 在麻醉诱导前20～60分钟使用，剂量为0.05～0.075 mg/kg肌内注射，老年患者剂量酌减；全麻诱导常静脉注射5～10 mg(0.1～0.15 mg/kg)。(3) 局部麻醉或椎管内麻醉辅助用药，分次静脉注射0.03～0.04 mg/kg。(4) ICU患者镇静，先静脉注射2～3 mg，继之以每小时0.05 mg/kg静脉滴注维持。

【制剂与规格】咪达唑仑注射液①1 ml：5 mg；②2 ml：10 mg；③3 ml：15 mg；④5 ml：5 mg。

17.2.5 围术期镇痛药

围术期镇痛用药分为阿片类和非阿片类，前者用于术中和术后镇痛，后者为前者的术后镇痛替代药。在应用过程中应注意：(1) 老年、体弱一般情况较差者，用量应减少。(2) 年轻、体壮、情绪紧张、甲状腺功能亢进患者，镇痛药剂量可适当增加。(3) 小儿对镇痛药耐受量小，易引起呼吸抑制，其用量应依全身状态严格按体重计算。

17.2.5.1 阿片类镇痛药

阿片类镇痛药主要用于术中和术后阻断伤害性刺激引起的疼痛和应激反应，已很少作为术前用药。术中给予阿片类镇痛药可以辅助区域阻滞，达到完善镇痛；可以减少全身麻醉药的用量，从而使麻醉后患者苏醒加快，且降低全身麻醉药的不良反应。但阿片类镇痛药减少吸入麻醉药是有封顶效应的。阿片类镇痛药不会使患者意识消失，可能产生呼吸抑制和肌肉僵直。术中可重复给予芬太尼或持续输注瑞芬太尼。长时间手术，特别是心脏手术宜选用舒芬太尼。瑞芬太尼起效迅速，作用时间极为短暂，长时间输注停药后，镇痛作用立即消失，须及时给予有效镇痛措施。术后可使用吗啡、芬太尼或舒芬太尼行患者自控静脉镇痛，也可以和局麻药一起行患者自控硬膜外镇痛。另外，哌替啶亦属阿片类镇痛药，可用于术前和术中。术后使用阿片类镇痛药应注意可能出现的呼吸抑制、恶心呕吐和瘙痒。

芬太尼[基(基)，保(甲/乙)]

Fentanyl

【适应证】本品为强效镇痛药，适用于麻醉前、中、后的镇静与镇痛，是目前复合全麻中常用的药物。(1) 用于麻醉前给药及麻醉诱导，并作为辅助用药与全麻及局麻药合用于各种手术。使用氟哌利多 2.5 mg 和本品 0.05 mg 的混合液，麻醉前给药，能使患者安静，对外界环境漠不关心，但仍能合作。(2) 用于手术前、后及术中等各种剧烈疼痛。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不良者慎用。(2) 妊娠期妇女慎用。(3) 下列情况慎用：如心律失常、慢性梗阻性肺部疾患，呼吸储备力降低及脑外伤昏迷、颅内压增高、脑肿瘤等易陷人呼吸抑制的患者及运动员慎用。(4) 老年人首次剂量应适当减量。(5) 按麻醉药品管理。(6) 本品务必在单胺氧化酶抑制药停用 14 日以上方可给药，而且应先试用小剂量（1/4 常用量），否则会发生严重不良反应甚至死亡。(7) 硬膜外注人本品镇痛时，可有全身瘙痒，而且仍有呼吸频率减慢和潮气量减小的可能，处理应及时。(8) 本品不是静脉全麻药，大量快速静脉注射时患者意识依然存在，常伴有术中知晓。(9) 快速注射本品可引起胸壁、腹壁肌肉僵硬而影响通气。(10) 本品有一定刺激性，不得误人气管、支气管及涂敷于皮肤上。

【禁忌证】支气管哮喘、呼吸抑制、呼吸道梗阻、对本品特别敏感的患者及重症肌无力患者。

【不良反应】严重不良反应为呼吸抑制、窒息、肌肉僵直及心动过缓，如不及时治疗，可发生呼吸停止、循环抑制及心脏停搏等。一般不良反应为眩晕、视物模糊、恶心、呕吐、低血压、胆道括约肌痉挛、喉痉挛及出汗等。偶有肌肉抽搐。本品有成瘾性。

【用法与用量】肥胖患者应避免过量用药，应根据理想体重计算用量。(1) 成人静脉注射：全麻时初量，①小手术按体重 1～2μg/kg（以芬太尼计，下同）；②大手术按体重 2～4μg/kg；③体外循环心脏手术时按体重 20～30μg/kg 计算全量，维持量可每隔 30～60 分钟给予初量的一半或连续静滴，一般每小时按体重 1～2μg/kg；④全麻同时吸人氧化亚氮按体重 1～2μg/kg；⑤局麻镇痛不全，作为辅助用药按体重 1.5～2μg/kg。成人麻醉前用药或手术后镇痛 0.7～1.5μg/kg。(2) 成人麻醉前或手术后镇痛：按体重肌内或静脉注射 0.7～1.5μg/kg。(3) 儿童镇痛：2 岁以下无规定，2～12 岁按体重 2～3μg/kg。(4) 成人手术后镇痛：硬膜外给药，初始量 0.1 mg，加 0.9% 氯化钠注射液稀释到 8 ml，每 2～4 小时可重复，维持量一次为初始量的 1/2。

【制剂与规格】枸橼酸芬太尼注射液：①1ml：0.05mg；②2ml：0.1mg；③10 ml：0.5mg（均以芬太尼计）。

芬太尼透皮贴剂：见 17.4.2.2。

瑞芬太尼[保(乙)]

Remifentanil

【适应证】用于全麻诱导和全麻中维持镇痛。

【注意事项】(1) 肝肾功能受损的患者不需调整剂量。肝肾功能严重受损的患者对瑞芬太尼呼吸抑制的敏感性增强，使

用时应监测。(2) 本品可通过胎盘屏障，产妇应用时有引起新生儿呼吸抑制的危险；孕妇用药，医生应权衡利弊。(3) 本品能经母乳排泄，因而哺乳期妇女不推荐使用；在必须使用时，医生应权衡利弊。(4) 下列情况慎用：运动员、心律失常、慢性梗阻性肺部疾患、呼吸储备力降低及脑外伤昏迷、颅内压增高、脑肿瘤等易陷入呼吸抑制的患者慎用。(5) 2 ~ 12 岁儿童用药与成人一致。2 岁以下儿童不推荐使用。(6) 65 岁以上老年患者用药时，初始剂量为成人剂量的一半，持续静滴给药剂量应酌减。(7) 按照麻醉药品管理。(8) 在推荐剂量下，本品能引起肌肉强直。肌肉强直的发生与给药剂量和给药速率有关。(9) 本品务必在单胺氧化酶抑制药停用 14 日以上方可使用，而且应先试用小剂量。(10) 使用本品出现呼吸抑制时应妥善处理，包括减小输注速率或暂时中断输注。(11) 本品能引起低血压和心动过缓，可以预先给予适量的抗胆碱能药缓解这些反应。(12) 本品停止给药后，5 ~ 10 分钟镇痛作用消失，对于预知需术后镇痛的患者，在停止本品前需给予适宜的替代镇痛药。(13) 在非麻醉诱导情况下，不得以患者的意识消失为药效目标而使用本品。(14) 本品不能单独用于全麻诱导，即使大剂量使用也不能保证使意识消失。(15) 本品不含任何抗菌剂及防腐剂，因此在稀释的过程中应保持无菌状态，稀释后的溶液应及时使用。(16) 本品处方中含有甘氨酸，因而不能于硬膜外和鞘内给药。(17) 禁与单胺氧化酶抑制药合用。(18) 禁与血、血清、血浆等血制品经同一路径给药。

【禁忌证】(1) 已知对本品中各种组分或其他芬太尼类药物过敏的患者禁用。(2) 重症肌无力及易致呼吸抑制患者禁用。(3) 支气管哮喘患者禁用

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、呼吸抑制、心动过缓、低血压和肌肉强直，上述不良反应在停药或降低输注速度后几分钟内即可消失。(2) 临床中还发现有寒战、发热、晕眩、视觉障碍、头痛、呼吸暂停、瘙痒、心动过速、高血压、激动、低氧血症、癫痫、皮肤潮红与过敏。(3) 较少见：便秘、腹部不适、口干、胃食管反流、吞咽困难、肠梗阻。心肌缺血、晕厥、肌肉强直、胸痛。咳嗽、呼吸困难、支气管痉挛、喉痉挛、喘鸣、鼻充血、胸腔积液、肺水肿、焦虑、不自主运动、震颤。皮疹、荨麻疹。尿潴留、少尿、贫血、淋巴细胞减少、白细胞减少、血小板减少等。

【用法与用量】肥胖患者应避免过量用药，应根据理想体重计算用量。本品只能用于静脉给药，特别适用于采用定量输注装置静脉持续滴注给药。给药前须用以下注射液之一溶解并定量稀释成 25μg/ml、50μg/ml 或 250μg/ml 浓度的溶液：①灭菌注射用水；② 5% 葡萄糖注射液；③ 0.9% 氯化钠注射液；④ 5% 葡萄糖氯化钠注射液；⑤ 0.45% 氯化钠注射液。本品用上述注射液稀释后可以与乳酸复方氯化钠注射液液或 5% 葡萄糖乳酸复方氯化钠注射液共行一个快速静脉输液通路。可能情况下，应采用专用静脉输液通路。应根据同时使用的其他麻醉药物和患者的体征，及时调整给药速度和剂量。临床推荐剂量，如表 17-6 所示。在上述推荐剂量下，本品显著减少维持麻醉所需的催眠药剂量。因此，异氟烷和丙泊酚应如上推荐剂量给药以避免麻醉过深。(1) 麻醉诱导：本品应与吸入麻醉药、催眠药（如丙泊酚、硫喷妥钠、咪达唑仑、氧化亚氮、七氟烷或氟烷）一并给药，用于诱导麻醉。成人按 0.5 ~ 1μg/kg 的剂量持续静滴。也可在静脉滴注前给予 0.5 ~ 1μg/kg 的初始剂量静推，静推时间应 > 60 秒。(2) 气管插管患者的麻醉维持：在气管插管后，应根据其他麻醉用药，依照上表指示减少本品输注速率。由于本品起效快，作用时间短，麻醉中的给药速率可以在 2 ~ 5 分钟增加 25% ~ 100% 或减小 25% ~ 50%，以获得满意的 μ 阿片受体兴奋的药理反应。患者麻醉过浅时，每隔 2 ~ 5 分钟给予 0.5 ~ 1μg/kg 剂量静脉注射给药，以加深麻醉深度。

【制剂与规格】注射用瑞芬太尼：① 1 mg；② 2 mg；③ 5 mg。

表 17-6 成年人给瑞芬太尼剂量表

用法		单剂量注射（μg/kg）	持续输注速度（分钟）	
			起始速率（每分钟 μg/kg）	范围（μg/kg）
麻醉诱导		1*	0.5 ~ 1	–
麻醉维持	氧化亚氮（66%）	0.5 ~ 1	0.4	0.1 ~ 2
	异氟烷（0.4 ~ 1.5 MAC#）	0.5 ~ 1	0.25	0.05 ~ 2
	丙泊酚（每分钟 100 ~ 200μg/kg）	0.5 ~ 1	0.25	0.05 ~ 2

.MAC 为最小肺泡浓度； * . 诱导中单剂量注射时，本品给药时间应 > 60 秒

舒芬太尼[保（乙）]

Sufentanil

【适应证】用于气管内插管，使用人工呼吸的全身麻醉；作为复合麻醉的镇痛用药；作为全身麻醉大手术的麻醉诱导和维持用药。

【注意事项】（1）肝和（或）肾功能不全者慎用本品。（2）妊娠期和哺乳的妇女，不能使用本品。（3）下列情况慎用：甲状腺功能低下、肺部疾患、老年人、肥胖，酒精中毒和使用过其他已知对中枢神经系统有抑制作用的药物的患者，在使用本品时均需特别注意，其用药量应酌情给予。建议对这些患者做较长时间的术后观察。（4）本品按麻醉药品管理。（5）大剂量给予本品以后可产生显著的呼吸抑制并持续至术后，可用特异性拮抗药纳洛酮逆转其呼吸抑制作用，必要时重复给药。（6）舒芬太尼可导致肌肉僵直，包括胸壁肌肉的僵直，可使用肌松药对抗之。（7）每次给药之后，都应对患者进行足够时间的监测。（8）术前应给予适量抗胆碱药物，以避免心动过缓甚至心搏停止。（9）在麻醉诱导期间可以加用氟哌利多，以防止恶心和呕吐的发生。（10）对接受过阿片类药物治疗或有过阿片类滥用史的患者，则可能需要使用较大的剂量。

【禁忌证】（1）对本品或其他阿片类药物过敏者禁用。（2）分娩期间或实施剖宫产手术期间婴儿剪断脐带之前，静脉内禁用本品。因本品可引起新生儿呼吸抑制。（3）本品禁用于新生儿、妊娠期和哺乳期的妇女。如果哺乳期妇女必须使用舒芬太尼，则应在用药后 24 小时方能再次哺乳。（4）在使用舒芬太尼前 14 日内用过单氨氧化酶抑制药者、急性肝卟啉症者、重症肌无力患者禁用。（5）因用其他药物而存在呼吸抑制者或患有呼吸抑制疾病者禁用。（6）低血容量、低血压患者禁用。

【不良反应】典型的阿片样症状，如呼吸抑制、呼吸暂停、骨骼肌强直（胸壁肌强直）、肌阵挛、低血压、心动过缓、恶心、呕吐和眩晕、缩瞳和尿潴留。在注射部位偶有瘙痒和疼痛。其他较少见的不良反应有：喉痉挛、过敏反应和心搏停止，偶尔可出现术后恢复期的呼吸再抑制。

【用法与用量】静脉内快速静脉注射或静脉滴注：用药的时间间隔长短取决于手术的持续时间。根据个体的需要可重复给予额外的（维持）剂量。（1）成人：①当作为复合麻醉的一种镇痛成分应用时，按体重 0.5 ~ 5.0μg/kg 做静脉注射，或者加入输液管中，在 2 ~ 10 分钟内滴完。当临床表现显示镇痛效应减弱时，可按体重 0.15 ~ 0.7μg/kg 追加维持剂量。②在以本品为主用于静脉给药的全身麻醉诱导时，用药总量可为 8 ~ 30μg/kg，当临床表现显示镇痛效应减弱时可按体重 0.35 ~ 1.4μg/kg 追加维持剂量。（2）儿童：用于 2 ~ 12 岁儿童以本品为主的全身麻醉诱导和维持中总量建议为 10 ~ 20μg/kg。如果临床表现镇痛效应降低时，可给予额外的剂量 1 ~ 2μg/kg。（3）其他：体弱患者和老年患者，以及已经用过能抑制呼吸的药物的患者，应减少

用量；而对于那些接受过阿片类药物的或有过阿片类滥用史的患者，则可能需要较大剂量。

【制剂与规格】舒芬太尼注射液：① 1ml : 75 μg（相当于舒芬太尼 50 μg）；② 2ml : 150 μg（相当于舒芬太尼 100 μg）；③ 5ml : 375μg（相当于舒芬太尼 250 μg）。

17.2.5.2 非阿片类镇痛药

主要用非甾体抗炎药（NSAIDs）。该类药不抑制呼吸，不影响胃肠蠕动，不引起药物依赖，因此非甾体抗炎药是阿片类术后镇痛药的有效替代药。但 NSAIDs 不足以缓解重度疼痛，且应注意其对胃黏膜刺激性及对血小板板功能和肾功能的不良影响。术后也可用其他镇痛药，如曲马多、布桂嗪。这两种药镇痛作用较 NSAIDs 强。

术后应用的 NSAIDs 有对乙酰氨基酚、布洛芬、塞来昔布、氟比洛芬、洛索洛芬、氯诺昔康、帕瑞昔布等。

17.2.6 中枢和呼吸抑制的拮抗药

呼吸抑制是使用阿片类镇痛药时需要注意的问题，可以通过进行人工通气治疗或使用纳洛酮拮抗。纳洛酮可以立即逆转由阿片类镇痛药导致的呼吸抑制，但由于纳洛酮的作用时间较短可能需要重复给药，同时纳洛酮也可拮抗镇痛效果。

氟马西尼是苯二氮䓬类药物拮抗药，可用于拮抗麻醉后或相似状况的苯二氮䓬类药物引起的中枢神经系统镇静作用。氟马西尼的半衰期和作用时间比地西泮或咪达唑仑短，所以患者可能发生再度镇静。

氟马西尼 [保（甲）]

Flumazenil

【适应证】(1) 终止用苯二氮䓬类药物诱导及维持的全身麻醉。(2) 作为苯二氮䓬类药物过量时中枢作用的特效逆转药。(3) 用于鉴别诊断苯二氮䓬类、其他药物或脑损伤所致的不明原因昏迷。

【注意事项】(1) 妊娠初期 3 个月内不得使用本品。(2) 哺乳期妇女慎用本品。(3) 不推荐用于长期接受苯二氮䓬类药物治疗的癫痫患者。(4) 使用本品时，应对再次镇静、呼吸抑制及其他苯二氮䓬类反应进行监控，监控的时间根据苯二氮䓬类的作用量和作用时间来确定。(5) 勿在神经肌肉阻断药的作用消失之前注射本品。(6) 不推荐用于苯二氮䓬类的依赖性治疗和长期的苯二氮䓬类戒断综合征的治疗。(7) 对于 1 周之内大剂量或较长时间使用苯二氮䓬类药物者，应避免快速注射本品，否则将引起戒断症状。(8) 使用本品最初 24 小时内，用药者应避免操作有危险性的机器或驾驶机动车。

【禁忌证】对此药及苯二氮䓬类过敏者，有严重抗抑郁药中毒症状者。对使用苯二氮䓬类药物以控制对生命构成威胁的情况（例如用于控制严重头部损伤的高颅内压或癫痫持续状态）。

【不良反应】少数患者在麻醉时用药会出现恶心、呕吐和面色潮红，在快速输注本品后偶尔会有焦虑、心悸、恐惧等不适感，一般不需处理。有癫痫病史、严重肝功能不全，以及苯二氮䓬类长期用药史的患者可能引起癫痫发作。

【用法与用量】(1) 用于终止用苯二氮䓬类药物诱导及维持的全身麻醉时，首次剂量在 15 秒内静脉注射本品 0.2 mg，若在首次注射后 60 秒内清醒程度未达标，一次可追加 0.1 mg，总量不超过 1 mg，通常剂量为 0.3 ~ 0.6 mg。(2) 作为苯二氮䓬类药物过量时中枢作用的特效逆转药：推荐的首次静脉注射剂量为 0.3 mg，如果在首次注射后 60 秒内清醒程度未达标，可重复使用直至患者清醒，或达总量 2 mg，如再度出现昏睡，可以每小时静脉滴注 0.1 ~ 0.4 mg，滴速应根据所要求的清醒程度进行个体调整。在重症监护情况下，对大剂量和（或）长时间使用苯二氮䓬类药物的患者，应缓慢给药并根据个体情况调整剂量。如出现意外的过度兴奋体征，可静脉注射地西泮 5 mg 或咪达唑仑 5 mg，并根据患者反应小心调整用量。(3) 用于鉴别诊断苯二氮䓬类、其他药物或脑损伤所致的不明原因昏迷：如果重复使用本品后，清醒程度及呼吸功能尚未显著改善，必须考虑到苯二氮䓬类药物以外的其他原因。

【制剂与规格】氟马西尼注射液：① 5 ml : 0.5 mg；② 10 ml : 1 mg。

纳洛酮[基(基). 保(甲)]

Naloxone

【适应证】(1) 用于阿片类药物复合麻醉术后，拮抗该类药物所致的呼吸抑制，促使患者苏醒。(2) 用于阿片类药物过量，完全或部分逆转阿片类药物引起的呼吸抑制。(3) 解救急性酒精中毒。(4) 用于急性阿片类药物过量的诊断。

【注意事项】(1) 伴有肝脏疾病、肾功能不全患者应慎用本品。(2) 妊娠妇女只有在必要时才考虑使用本品，轻至中度高血压患者在临产时使用纳洛酮应密切监护，以免发生严重高血压。(3) 哺乳期应慎用本品。(4) 已知或可疑的阿片类药物躯体依赖患者，包括其母亲为阿片类药物依赖者的新生儿，突然或完全逆转阿片作用可能会引起急性戒断综合征。(5) 老年人应从小剂量开始。(6) 由于某些阿片类药物的作用时间长于纳洛酮，因此应该对使用本品效果很好的患者进行持续监护，必要时应重复给药。(7) 本品对非阿片类药物引起的呼吸抑制和左丙氧芬引起的急性毒性的控制无效。只能部分逆转部分性激动药或混合激动药／拮抗药（如丁丙诺啡和喷他佐辛）引起的呼吸抑制，或需要加大纳洛酮的用量。如果不能完全有效，在临床上需要用机械辅助治疗呼吸抑制。(8) 在术后突然逆转阿片类抑制可能引起恶心、呕吐、出汗、发抖、心悸、血压升高、癫痫发作、室性心动过速和心室颤动、肺水肿以及心脏停搏，严重的可导致死亡。术后患者使用本品过量可能逆转痛觉缺失并引起患者激动。(9) 有心血管疾病史，或接受其他有严重的心血管不良反应（低血压、室性心动过速或心室颤动、肺水肿）的药物治疗的患者应慎用本品。(10) 应用纳洛酮拮抗大剂量麻醉镇痛药后，由于痛觉恢复，可产生高度兴奋。表现为血压升高，心率增快，心律失常，甚至肺水肿和心室颤动。(11) 由于此药作用持续时间短，用药起作用后，一旦其作用消失，可使患者再度陷入昏睡和呼吸抑制。故需注意维持药效。(12) 阿片类中毒患儿对本品的反应很强，因此需要对其进行至少 24 小时的密切监护，直到本品完全代谢。(13) 本品不应给予有明显戒断症状和体征的患者，或者尿中含有阿片的患者。(14) 有些患者特别是阿片耐受患者对低剂量的本品即可发生反应，静脉注射 0.1 mg 的本品就可以起诊断作用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】(1) 术后患者使用本品时偶见：低血压、高血压、室性心动过速和心室颤动、呼吸困难、肺水肿和心脏停搏。(2) 类阿片依赖：对阿片类药物产生躯体依赖的患者突然逆转其阿片作用可能会引起急性戒断综合征，包括但不局限于躯体疼痛、发热、出汗、流鼻涕、喷嚏、竖毛、打哈欠、无力、寒战或发抖、神经过敏、不安或易激惹、腹泻、恶心或呕吐、腹部痛性痉挛、血压升高、心悸等症状和体征。(3) 对新生儿，阿片戒断症状可能有：惊厥、过度哭泣、反射性活动过多。(4) 术后使用本品和减药时引起的不良反应按器官系统分类如下：①心血管系统：高血压、低血压、皮肤热潮红或发红、心脏停搏或心力衰竭、心悸、心室颤动和室性心动过速。据报道由此引起的后遗症有死亡、昏迷和脑病。②胃肠道：恶心、呕吐。③神经精神系统：惊厥、感觉异常、癫痫大发作惊厥、激动、幻觉、发抖。④呼吸道、胸和膈：肺水肿、呼吸困难、呼吸抑制、低氧血症。⑤皮肤：非特异性注射点反应、出汗。

【用法与用量】本品可静脉滴注、静脉注射或肌内注射给药。静脉注射起效最快，适合在急诊时使用。静脉滴注：本品 2 mg 用 500 ml 氯化钠注射液或葡萄糖溶液稀释，使浓度达到 0.004 mg/ml。混合液在 24 小时内使用，超过 24 小时剩余的混合液必须丢弃。根据患者反应控制滴注速度。(1) 成人：①阿片类药物过量，首次可静脉注射本品 0.4 ~ 2 mg，如果未获得呼吸功能的理想的对抗和改善作用，可隔 2 ~ 3 分钟重复注射给药。如果给 10 mg 还未见反应，就应考虑此诊断问题。如果不能静脉给药，可肌内给药。②部分纠正在手术使用阿片类药物后阿片的抑制效应，通常较小剂量本品即有效。首次纠正呼吸抑制时，应每隔 2 ~ 3 分钟，静脉注射 0.1 ~ 0.2 mg，直至产生理想的效果，即有通畅的呼吸和清醒度，无明显疼痛和

不适。大于必需剂量的本品可明显逆转痛觉缺失和升高血压。同样，逆转太快可引起恶心、呕吐、出汗或循环系统负担增加。③ 1 ~ 2 小时时间间隔内需要重复给予本品的量取决于最后一次使用的阿片类药物的剂量、给药类型（短作用型还是长作用型）与间隔时间。④重度酒精中毒 0.8 ~ 1.2 mg，一小时后重复给药 0.4 ~ 0.8 mg。(2) 儿童：①阿片类药物过量，儿童静脉注射的首次剂量为 0.01 mg/kg。如果此剂量没有在临床上取得满意的效果，接下去则应给予 0.1 mg/kg（如果不能静脉注射，可以分次肌内注射）。必要时可用灭菌注射用水将本品稀释。②术后阿片类药物抑制效应，参考成人术后阿片抑制项下的建议和注意事项。在首次纠正呼吸抑制效应时，每隔 2 ~ 3 分钟静脉注射本品 0.005 ~ 0.01 mg，直至达到理想逆转程度。(3) 新生儿：阿片类药物引起的抑制，静脉注射、肌内注射或皮下注射的常用初始剂量为 0.01 mg/kg，可按照成人术后阿片类抑制的用药说明重复该剂量。纳洛酮激发试验。用来诊断怀疑阿片耐受或急性阿片过量。静脉注射本品 0.2 mg，观察 30 秒钟看是否出现阿片戒断的症状和体征。如果未出现，或未达到逆转的作用，呼吸功能未得到改善，可间隔 2 ~ 3 分钟重复用药，每注射 0.6 mg 观察 20 分钟。如果纳洛酮的给药总量达到 10 mg 后仍未观察到反应，则阿片类药物诱发的或部分由阿片类药物引起毒性的诊断可能有误。在不能进行静脉注射给药时，可选用肌内注射或皮下注射。

【制剂与规格】盐酸纳洛酮注射液：①1 ml：0.4 mg；② 1 ml：1 mg；③ 2 ml：2 mg；④ 10 ml：4 mg。

17.2.7 围手术期治疗用人工胶体液

液体治疗是麻醉手术期间维持手术患者生命体征稳定的重要措施。手术中患者需要补充正常的生理需要量以及麻醉和手术所导致的循环血容量改变和体液丢失，维持良好的组织灌注和内环境稳定，避免细胞代谢紊乱和器官功能受损。

麻醉手术期间的液体需要量包括：一日正常生理需要量；术前禁食所致的液体缺失量或手术前累计缺失量；麻醉手术期间的液体再分布；麻醉导致的血管扩张；术中失血失液量。

术中失血导致血容量减少，需要输注血液制品、晶体液和胶体液。部分失血患者可不需要给予血制品，依靠晶体液和人工胶体液维持血容量。

等渗胶体溶液是良好的血管内扩容药，可以迅速恢复血管内容量，同时能够维持胶体渗透压、减轻组织水肿，成为理想的血浆代用品。人工胶体溶液运输储存方便，供应充足，随时可用，无不同血型和传播感染性疾病之虑，减少了用血量。作为一种大颗粒混悬液电解质含量不同，生理特性存在差异；不同胶体溶液的半衰期和血管内滞留时间不同；胶体溶液的不良反应包括，影响凝血功能和肾功能；存在过敏等。随着近年来胶体溶液的换代和不断改进，这些不良反应已明显减少。

琥珀酰明胶[保（乙）]

Succinylated Gelatin

【适应证】本品为胶体性血浆代用品，适用于下述情况：低血容量性休克，手术创伤、烧伤及感染的血容量补充，手术前后及手术间的稳定血液循环，体外循环（血液透析，人工心肺机）血液稀释，脊髓及硬膜外麻醉后的低血压的预防。

【注意事项】(1) 妊娠期或哺乳期妇女资料不多，应用时应权衡利弊。(2) 以下情况慎用，如水分过多、肾衰竭、有出血倾向、肺水肿、钠或钾缺乏以及对输液成分过敏等患者。(3) 心衰竭可能伴有循环系统超负荷，此时输液应缓慢进行。(4) 老年人应控制血细胞比容不低于 30%，并防止循环超负荷。(5) 失血量超过循环总量 25% 时，应输全血或红细胞。(6) 使用本品不会干扰交叉配血。(7) 本品含钙量、含钾量低，可用于接受洋地黄的患者或肾功能较差的患者。(8) 输注本品期间下列化验指标可能不稳定：血糖、红细胞沉降率、尿液比重、蛋白、双缩脲、脂肪酸、胆固醇、果糖、山梨醇脱氢酶。

【禁忌证】对本品有过敏反应、有循环超负荷、水潴留、严重肾衰竭、出血倾向、肺水肿的患者。

【不良反应】偶见严重过敏反应。可出现轻微荨麻疹。

【用法与用量】静脉滴注：快速输注时应加温液体，但不超过37℃。(1) 血液或血浆丢失不严重，或术前或术中预防性治疗，一般1～3小时输注500～1 000 ml。(2) 低血容量休克，容量补充和维持时，可在24小时内输注10～15 L（但血细胞比容不应低于25%，年龄大者不应低于30%，同时避免血液稀释引起的凝血异常）。(3) 严重急性失血致生命垂危时，可在5～10分钟加压输注500 ml，进一步输注量视缺乏程度而定。

【制剂与规格】琥珀酰明胶注射液：500 ml：20 g（本品1 000 ml内含琥珀酰明胶40 g、氯化钠7.01 g、氢氧化钠1.36 g、注射用水969 g）。

羟乙基淀粉[保(乙)]

Hydroxyethyl Starch

(1) 羟乙基淀粉（130/0.4），其活性成分为聚合淀粉，平均相对分子量为130 000 Da，摩尔取代级0.4。(2) 羟乙基淀粉（200/0.5），其活性成分为聚合淀粉，平均相对分子量为200 000 Da，摩尔取代级0.5。

【适应证】本品为血浆容量扩充剂，用于治疗和预防与手术、创伤、感染、烧伤有关的血容量不足或休克；减少手术中对供血的需要，节约用血，如急性等容性血液稀释（ANH）。

【注意事项】(1) 慢性及严重肝病患者慎用。(2) 避免过量使用引起液体负荷过重，特别是心功能不全和严重肾功能不全的患者，肾功能进一步损害和液体负荷过重的危险性增加，应调整剂量。(3) 妊娠及哺乳期妇女慎用。个别情况利大于弊时，方可用于妊娠期患者。(4) 为防止重度脱水，使用本品前应先给予晶体溶液。(5) 严重凝血功能紊乱的患者应慎用，如严重Willebrand病的患者。运动员慎用。(6) 应补充充足的液体，定期监测肾功能和液体平衡。(7) 应密切监测血清电解质水平。(8) 应避免与其他药物混合。如果在特别情况下需要与其他药物混合，要注意相容性、无菌及均匀混合。(9) 若患者有耳神经障碍时，其给药剂量与瘙痒发生率之间有相关关系，在这种病例中最好把剂量适当减少，同时保证患者有足够的体液摄入量。

【禁忌证】(1) 液体负荷过重如肺水肿者、液体严重缺失者（脱水）、少尿或无尿的肾衰竭（血肌酐 >2 mg/dl）、接受透析治疗者。(2) 严重凝血障碍、严重充血性心力衰竭、颅内出血者。(3) 严重高钠或高氯血症者。(4) 已知对羟乙基淀粉和（或）本品中其他成分过敏者。

【不良反应】(1) 极个别患者可能发生类过敏反应。(2) 长期大剂量使用羟乙基淀粉，患者会出现皮肤瘙痒。(3) 使用羟乙基淀粉时，可能发生与剂量相关的凝血功能异常。(4) 使用本品后，血清淀粉酶的浓度会升高，可能干扰胰腺炎的诊断。

【用法与用量】(1) 羟乙基淀粉（130/0.4）：静脉滴注：初始10～20 ml，应缓慢输入，并密切观察患者（防止可能发生的过敏反应）。一日剂量及输注速度应根据患者失血量、血流动力学参数的维持或恢复及血液稀释效果确定。没有心血管或肺功能危险的患者使用胶体扩容剂时，血细胞比容应不低于30%。一日最大剂量按体重50 ml/kg。根据患者的需要，本品在数日内可持续使用，治疗持续时间取决于低血容量的时间和程度，以及血流动力学参数和血液稀释效果。(2) 羟乙基淀粉（200/0.5）：①治疗和预防血容量不足及休克（容量代替治疗），推荐剂量：静脉注射，6%注射液一日剂量不超过33 ml/kg或10%注射液不超过20 ml/kg，最大滴注速度为每小时20 ml/kg。②减少手术中供血量（急性等容血液稀释-ANH）的推荐剂量：手术之前即刻开展ANH，按1∶1的比例，以本品替自体血液。ANH后，血细胞比容应不低于30%。6%的注射液用量如下：一日剂量：1 000～1 500 ml，放血量1 000～1 500 ml（自体血）。滴注速度：15～30分钟1 000 ml，放血速度15～30分钟1 000 ml。③治疗性血液稀释的推荐剂量：目的是降低血细胞比容，可分为等容血液稀释（放血）和高容血液稀释（不放血），按给药剂量可分为低（250 ml）、中（500 ml）、高（1 000 ml）

三种。一日剂量：低(250 ml)，中(500 ml)，高（1 000ml)。滴注速度分别为：0.5 ~ 2 小时 250 ml；4 ~ 6 小时 500 ml；8 ~ 24 小时 1 000 ml。④急性等容血液稀释（ANH）通常在手术之前进行一次。如果血细胞比容正常，可重复使用。治疗性血液稀释，建议治疗 10 日。

【制剂与规格】6% 羟乙基淀粉（130/0.4）注射液：① 250 ml：15g 羟乙基淀粉(130/0.4) 与 2.25 g 氯化钠；② 500 ml：30 g 羟乙基淀粉（130/0.4）与 4.5 g 氯化钠。

6% 羟乙基淀粉（200/0.5）注射液：500 ml：30 g 羟乙基淀粉（200/0.5）与 4.5 g 氯化钠。

10% 羟乙基淀粉（200/0.5）注射液：500 ml：50 g 羟乙基淀粉（200/0.5）与 4.5 g 氯化钠。

右旋糖酐[基(基)，保(甲)]

Dextran

【适应证】用于抗低血容量休克、预防术后血栓和血栓性静脉炎。低分子右旋糖酐用于抗失血性休克、创伤、烧伤、中毒性休克、脑血栓、心绞痛和心肌梗死，并预防因休克引起的弥散性血管内凝血，

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者慎用。(2) 小分子右旋糖酐不能代替全血应用，在抢救大出血时应与全血同时应用。发生由革兰阳性细菌感染所引起的感染性休克时，肾脏灌注量异常减弱，应用中分子右旋糖酐时宜注意。一日量超过 1 000 ml 时，少数患者可出现凝血时间延长，引起出血倾向或低蛋白血症，宜控制用量不超过一日 1 500 ml。(3) 右旋糖酐具有抗原性，少数人可能发生过敏或过敏性休克，为安全起见，应用前宜做皮肤敏感试验，抽取药液 0.1 ml 皮下注射，观察 15 分钟，或初始滴注时观察 10 ~ 15 分钟，若出现过敏反应时立即停药，并皮下注射肾上腺素和静脉注射升压药。

【禁忌证】小分子右旋糖酐的利尿作用较强，可引起血钾降低，对严重肾病者禁用。充血性心力衰竭者、有出血性疾病者禁用。肾衰竭、严重血小板减少者禁用。

【不良反应】少见皮肤瘙痒、荨麻疹、红色丘疹、哮喘等过敏反应，极少数出现过敏性休克，多发生于滴注初始几分钟内，立即出现胸闷、面色苍白、血压下降，如及时抢救可恢复，偶见发热、持续性高热或低热、寒战、淋巴结肿大、关节痛、血钾降低；用量过大可致贫血、出血、创面渗血、鼻出血、牙龈出血、皮肤黏膜出血、血尿、月经血量增多等。

【用法与用量】静脉滴注：(1) 中分子右旋糖酐：用于抗低血容量休克，一次 500 ml，儿童一次 10 ~ 15 ml/kg，滴速为每分钟 20 ~ 40 ml，最大剂量一日 1 000 ~ 1 500 ml；用于预防术后血栓和血栓性静脉炎，可在术中或术后给予 500 ml，第 2 日再给予 500 ml，对高危患者可用至 10 日。(2) 低分子右旋糖酐：用于抗失血性休克、创伤、烧伤、中毒性休克、脑血栓、心绞痛和心肌梗死，并预防因休克引起的弥散性血管内凝血，一次 250 ~ 500 ml，最大剂量不超过一日 20 ml/kg，儿童一次 5 ml/kg，用于抗休克时滴速为每分钟 20 ~ 40 ml，在 15 ~ 30 分钟滴注 500 ml，用于脑血栓时滴速宜缓慢，连续 7 ~ 14 次为 1 个疗程；用于预防手术血栓形成，于术中或术后给予 500 ml，术后 1 ~ 2 日再给予 500 ml，静脉滴注 2 ~ 4 小时，连续应用可至术后第 10 日；用于血管栓塞性疾病，一次 250 ~ 500 ml，一日或隔日 1 次，连续 7 ~ 10 次。(3) 小分子右旋糖酐：用于急性失血性休克、急性心肌梗死、心绞痛、脑血栓形成和供血不全，一次 500 ~ 1 000 ml，滴速为每分钟 5 ~ 15 ml，待血压上升后可酌情减慢。

【制剂与规格】右旋糖酐 40 葡萄糖注射液（10%）：① 100 ml：10 g；② 250 ml：25 g；③ 500 ml：50 g。

6% 右旋糖酐 40 葡萄糖注射液：均含 5% 葡萄糖。① 100 ml：6 g；② 250 ml：15 g；③ 500 ml ：30 g。

10% 右旋糖酐 40 氯化钠注射液：①100 ml：10g；② 250 ml：25g；③500 ml：50g。

右旋糖酐 40 氯化钠注射液（6%）：均含 0.9 % 氯化钠。① 100 ml：6 g；② 250 ml：15g；③ 500 ml：30 g。

6% 右旋糖酐 70 葡萄糖注射液：均含 5%葡萄糖。① 500 ml ∶ 30 g；② 10%，500ml ∶ 50g。

6% 右旋糖酐 70 氯化钠注射液：均含 0.9%氯化钠。① 500 ml∶30 g；② 10%，500 ml ∶ 50g。

17.3 局部麻醉及其用药

局麻药通过可逆性阻滞神经纤维传导而起作用。不同的局麻药的效能、毒性、作用时间、稳定性、水溶性和黏膜渗透能力相差很大。这些差异就决定了各种局麻药的适应证。局麻药有多种用药方法：表面使用，局部浸润，局部静脉麻醉(Bier's block)，神经丛阻滞，硬膜外腔阻滞或蛛网膜下腔阻滞。局麻药也可用于缓解术后疼痛，以减少对镇痛药的需求。普鲁卡因用于局部浸润、神经丛阻滞、硬膜外腔阻滞及蛛网膜下腔阻滞。但由于其麻醉效能弱、作用时间短，现在仅用于局部浸润。丁卡因用于表面麻醉、硬膜外腔阻滞、蛛网膜下腔阻滞及神经丛阻滞。利多卡因主要用于浸润麻醉、神经丛阻滞及硬膜外腔阻滞。布比卡因和罗哌卡因用于神经丛阻滞、蛛网膜下腔和硬膜外腔阻滞以及术后硬膜外镇痛及分娩镇痛。左布比卡因主要用于硬膜外腔阻滞。

为了评估局麻药的安全剂量，考虑药物的吸收和排泄及其效能是重要的。此外还应考虑其他因素：患者的年龄、体重、体质、合并疾病、用药部位的血供及给药持续时间。

给药时应极为谨慎，防止将药物注入血管而发生意外。口腔周围的局部麻醉有可能影响吞咽功能，从而增加误吸的危险。

局麻药的毒性作用通常是由其过高的血药浓度所致，局麻药的毒性作用首先表现为耳鸣、口周感觉异常和眩晕，继而表现为镇静和颤搐；严重时可发生惊厥。在静脉注射给药时，惊厥和循环衰竭的发生常非常迅速。超敏反应多见于酯类局麻药，如普鲁卡因和丁卡因；而酰胺类局麻药则少见，如利多卡因、布比卡因和罗哌卡因。

利多卡因 [基(基)，保(甲)]

Lidocaine

【适应证】(1) 盐酸利多卡因：主要用于浸润麻醉、硬膜外麻醉、表面麻醉（包括在胸腔镜检查或腹腔手术时做黏膜麻醉用）及神经传导阻滞。亦可用于治疗急性心肌梗死后室性期前收缩和室性心动过速，以及洋地黄类中毒、心脏外科手术及心导管引起的室性心律失常，对室上性心律失常通常无效。(2) 碳酸利多卡因：低位硬膜外麻醉及臂丛神经阻滞麻醉。

【注意事项】(1) 对其他局麻药过敏者，可能对本品也过敏。(2) 肝肾功能障碍者慎用。(3) 妊娠期妇女慎用。(4) 以下情况慎用：肝血流量减低、充血性心力衰竭、严重心肌受损、低血容量及休克等患者。(5) 新生儿用药可引起中毒，早产儿应慎用。(6) 老年人用药应根据需要和耐受程度调整剂量，＞ 70 岁的患者剂量应减半。(7) 防止误入血管，注意局麻药中毒症状的诊治。(8) 应严格掌握本品浓度和用药总量，超量可引起惊厥及心脏停搏。(9) 其体内代谢较普鲁卡因慢，有蓄积作用，可因蓄积引起中毒而发生惊厥。(10) 某些疾病如急性心肌梗死患者常伴有 α1-酸性蛋白增加，利多卡因蛋白结合也增加而降低了游离血药浓度。(11) 心电图 P-R 间期延长或 QRS 波增宽，出现其他心律失常或原有心律失常加重者应立即停药。(11) 用药期间应注意检查血压、监测心电图，并备有抢救设备。

【禁忌证】(1) 盐酸利多卡因：对局部麻醉药过敏者禁用。阿-斯综合征（急性心源性脑缺血综合征）、预激综合征、严重心传导阻滞（包括窦房、房室及心室内传导阻滞）患者静脉禁用。(2) 碳酸利多卡因：对于有利多卡因有过敏史、二或三度房室传导阻滞、有癫痫大发作、肝功能严重不全及休克患者。

【不良反应】本品可作用于中枢神经系统，引起嗜睡、感觉异常、肌肉震颤、惊厥、昏迷及呼吸抑制等不良反应。可引起低血压及心动过缓。血药浓度过高，可引起心房传导速度减慢、房室传导阻滞及抑制心肌收缩力和心排血量下降。

【用法与用量】(1) 盐酸利多卡因。麻醉用：①成人常用量。表面麻醉：2% ~ 4% 溶液一次不超过 100 mg。注射给药时一次量不超过 4.5 mg/kg（不合用肾上腺素）或 7 mg/kg（合用 1∶200 000 浓度的肾上腺素）。骶管阻滞用于分娩镇痛：用 1.0% 溶液，以 200 mg 为限。硬脊膜外阻滞：胸腰段用 1.5% ~ 2.0% 溶液，250 ~ 300 mg。浸润麻醉或静脉注射区域阻滞：用 0.25% ~ 0.5% 溶液，50 ~ 300 mg。外周神经阻滞：臂丛（单侧）用 1.5% 溶液，250 ~ 300 mg；牙科用 2% 溶液，20 ~ 100 mg；肋间神经（每支）用 1% 溶液，30 mg，300 mg 为限；宫颈旁浸润用 0.5% ~ 1.0% 溶液，左右侧各 100 mg；椎旁脊神经阻滞（每支）用 1.0% 溶液，30 ~ 50 mg，300 mg 为限；阴部神经阻滞用 0.5% ~ 1.0% 溶液，左右侧各 100 mg。交感神经节阻滞：颈星状神经阻滞用 1.0% 溶液，50 mg；腰麻用 1.0% 溶液，50 ~ 100 mg。一次限量，不加肾上腺素为 200 mg（4 mg/kg），加肾上腺素为 300 ~ 350 mg（6 mg/kg）；静脉注射区域阻滞，极量 4 mg/kg；治疗用静脉注射，第一次初量 1 ~ 2 mg/kg，极量 4 mg/kg，成人静滴每分钟以 1 mg 为限；②儿童常用量。随个体而异，一次给药总量不得超过 4.0 ~ 4.5 mg/kg，常用 0.25% ~ 0.5% 溶液，特殊情况才用 1% 溶液。(2) 碳酸利多卡因。①硬膜外阻滞：根据需要阻滞的节段数和患者情况调节用量。成人常用量为 10 ~ 15 ml。肝、心功能不全者用量酌减；②神经干（丛）阻滞：一次 15 ml，极量 20 ml。

【制剂与规格】盐酸利多卡因注射液：① 5 ml ∶ 50 mg；② 5 ml ∶ 100 mg；③ 10 ml∶200 mg；④ 20 ml ∶400 mg。

碳酸利多卡因注射液：① 5 ml∶86.5 mg；② 10 ml∶173 mg（均按利多卡因计算）。

布比卡因[基(基)，保(甲)]

Bupivacaine

【适应证】用于局部浸润麻醉、外周神经阻滞和椎管内阻滞。

【注意事项】(1) 12 岁以下儿童慎用。(2) 本品毒性较利多卡因大 4 倍，心脏毒性尤应注意，其引起循环衰竭和惊厥比值较小（CC/CNS=3.7±0.5），心脏毒性症状出现较早，往往循环衰竭与惊厥同时发生，一旦心脏停搏，复苏甚为困难。(3) 局部浸润麻醉儿童用 0.1% 浓度。

【禁忌证】对本品过敏者、肝肾功能不全者禁用。

【不良反应】(1) 少数患者可出现头痛、恶心、呕吐、尿潴留及心率减慢等。如果出现严重不良反应，可静脉注射麻黄碱或阿托品。(2) 过量或误入血管可产生严重的毒性反应，一旦发生心肌毒性几乎无复苏希望。

【用法与用量】(1) 臂丛神经阻滞：0.25% 溶液 20 ~ 30 ml 或 0.375% 溶液 20 ml（50 ~ 70 mg）。(2) 骶管阻滞：0.25% 溶液 15 ~ 30 ml（37.5 ~ 75 mg），或 0.5% 溶液 15 ~ 20 ml（75 ~ 100 mg）。(3) 硬脊膜外阻滞：0.25% ~ 0.375% 溶液可以镇痛，0.5% 溶液可用于一般的腹部手术等。(4) 局部浸润：总用量一般以 175 ~ 200 mg（0.25%，70 ~ 80 ml）为限，24 小时内分次给药，一日极量 400 mg。(5) 交感神经节阻滞的总用量：50 ~ 125 mg（0.25%，20 ~ 50 ml）。(6) 蛛网膜下腔阻滞常用量：5 ~ 15 mg，并加 10% 葡萄糖成高比重或用脑脊液稀释成近似等比重液。

【制剂与规格】盐酸布比卡因注射液：① 5 ml ∶ 12.5 mg；② 5 ml ∶ 25 mg；③ 5ml∶37.5 mg；④ 2 ml∶15 mg。

左布比卡因[保(乙)]

Levobupivacaine

【适应证】主要用于硬膜外阻滞麻醉。

【注意事项】(1) 肝病患者须慎用。(2) 妊娠期妇女用本品应权衡利弊。(3) 使用时不得过量，过量可导致低血压、抽搐、心脏停搏、呼吸抑制及惊厥。(4) 如果出现严重低血压或心动过缓，可静脉注射麻黄碱或阿托品。(5) 如出现肌肉震颤、痉挛可给予巴比妥类药。(6) 给予局部麻醉注射液后须密切观察心血管、呼吸的变化和患者的意识状态，患者出现下列症状可能是中毒迹象：躁动不安、焦虑、语无伦

次、口唇麻木与麻刺感，金属异味、耳鸣、头晕、视物模糊、肌肉震颤、抑郁或嗜睡。(7) 本品不宜静脉内注射用药，所以在注射给药中，回抽吸有无血液以确认不是血管内注射是必需的。(8) 左布比卡因注射液的溶液不用于产科子宫旁组织的阻滞麻醉。蛛网膜下腔阻滞迄今无临床应用资料。(9) 本品不用于12岁以下儿童，其安全性有待证实。

【禁忌证】(1) 肝肾功能严重不全、低蛋白血症、对本品过敏患者或对酰胺类局麻药过敏者禁用。(2) 若本品与盐酸肾上腺素混合使用时，禁用于毒性甲状腺肿，严重心脏病或服用三环抗抑郁药等患者。

【不良反应】低血压、恶心、术后疼痛、发热、呕吐、贫血、瘙痒、疼痛、头痛、便秘、眩晕、胎儿窘迫等，偶见哮喘、水肿、少动症，不随意肌收缩，痉挛、震颤、晕厥、心律失常、期前收缩、心房颤动、心脏停搏、肠梗阻、胆红素升高、意识模糊、窒息、支气管痉挛、呼吸困难、肺水肿、呼吸功能不全、多汗、皮肤变色等。

【用法与用量】成人。用于神经阻滞或浸润麻醉，一次最大剂量150 mg。外科硬膜外阻滞，0.5% ~ 0.75%，10 ~ 20 ml、50 ~ 150 mg 部分至完全运动阻滞。

【制剂与规格】盐酸左布比卡因注射液：① 5 ml：37.5 mg；② 10 ml：50 mg。

普鲁卡因 [基(基)、保(甲)]

Procaine

【适应证】用于浸润麻醉、神经阻滞麻醉、蛛网膜下腔麻醉、硬膜外麻醉及封闭疗法等。

【注意事项】(1) 给药前必须做皮内敏感试验，注射部位周围有较大红晕时应谨慎，必须分次给药，有丘肿者应作较长时间观察，一次不超过30 ~ 50 mg，证明无不良反应时，方可继续给药，有明显丘肿主诉不适者，立即停药。(2) 对其他酯类局麻过敏者，也可对本品过敏。(3) 妊娠期妇女用本品应权衡利弊。(4) 下列情况慎用，如房室传导阻滞、休克、已用足量洋地黄者、早产、子痫和虚弱的产妇、老年体弱者。(5) 儿童用本品的毒性反应比成人严重，故慎用。(6) 除有特殊原因外，一般不必加肾上腺素，如确要加入，应在临用时即加，且高血压患者应谨慎。(7) 药液不得注入血管内，给药时应反复抽吸，不得有回血。(8) 本品的毒性与给药途径、注速、药液浓度、注射部位、是否加入肾上腺素等有关，应严格按照本品说明书给药。营养不良、饥饿状态更易出现毒性反应，应予减量。(9) 给予最大剂量后应休息1小时以上方准行动。(10) 蛛网膜下腔阻滞时尤其需调节阻滞平面，随时观察血压和脉搏的变化。(11) 用药前后及用药时应监测：①呼吸与循环系统的功能状态；②中枢神经活动的兴奋或抑制状态；③出现严重毒性反应后，应监测体温，以防发生中枢性高热。(12) 注射器械不可用碱性物质如肥皂，煤酚皂溶液等洗涤消毒，注射部位应避免接触碘，否则会引起普鲁卡因沉淀。(13) 普鲁卡因目前已很少使用，其有效性与利多卡因相似，但作用时间较短。本品不易在组织内扩散，故镇痛效应较弱。

【禁忌证】心、肾功能不全，重症肌无力、败血症、恶性高热患者及对本品过敏者。

【不良反应】(1) 神经毒性分为兴奋型和抑制型：①兴奋型表现为精神紧张、好语多动、心率增快，较严重时有呼吸急促、烦躁不安、血压升高、发绀甚至肌肉震颤直到惊厥，最终导致呼吸停止，心脏停搏。②抑制型表现为淡漠、嗜睡、意识消失，较严重时呼吸浅慢、间歇呼吸、脉搏徐缓、血压下降、最终导致心脏停搏。(2) 本品可有高敏反应和过敏反应，个别患者可出现高铁血红蛋白症；剂量过大，吸收速度过快或误入血管可致中毒反应。

【用法与用量】(1) 局部浸润麻醉：阻滞范围较大的，一般用0.25% ~ 0.5%溶液；阻滞范围较小的，用1%溶液。本品一次用量为：不加肾上腺素时不得超过0.5 g，加肾上腺素时不得超过1g。每小时不得超过1.5 g。(2) 神经传导阻滞麻醉：使用本品1% ~ 2%溶液。本品一次用量为：不加肾上腺素时不得超过0.5 g，加肾上腺素时不得超过1 g（指、趾的麻醉不得加肾上腺素）。每小时不得超过1 g。(3) 蛛网膜下腔阻滞麻醉：一次不

宜超过150 mg，麻醉作用约可持续1小时，主要用于腹部以下持续时间不长的手术。(4) 硬膜外麻醉：2%溶液，一般一次注射20 ~ 25 ml。每小时不得超过0.75 g。(5) 封闭疗法：将本品注射于与病变有关的神经周围或病变部位，用量同局部浸润麻醉。

【制剂与规格】盐酸普鲁卡因注射液：① 2 ml : 40mg；② 10 ml : 100 mg；③ 20 ml : 50 mg；④ 20 ml : 100 mg。

注射用盐酸普鲁卡因：150 mg。

罗哌卡因[保(乙)]

Ropivacaine

【适应证】(1) 外科手术麻醉：①硬膜外麻醉，包括剖宫产术；②区域阻滞。(2) 急性疼痛控制：①持续硬膜外输注或间歇性单次用药，如术后或分娩疼痛；②区域阻滞。

【注意事项】(1) 由于盐酸罗哌卡因在肝脏代谢，所以严重肝病患者应慎用，因药物排泄延迟，重复用药时需减少剂量。(2) 通常情况下肾功能不全患者如用单一剂量或短期治疗不需调整用药剂量，慢性肾功能不全患者伴有酸中毒及低蛋白血症，发生全身性中毒的可能性增大，故慎用。(3) 妊娠期妇女慎用。(4) 本品不用于12岁以下的儿童。(5) 对于高龄或伴有其他严重疾患诸如患有心脏传导部分或完全阻滞、严重肝病或严重肾功能不全等疾病而需施用区域麻醉的患者，在实施麻醉前，应尽力改善患者的状况，药物剂量也应随之调整。Ⅲ类抗心律失常药（如胺碘酮）可能与罗哌卡因存在对心脏的相加作用，故应进行严密监护。(6) 本品用于硬膜外麻醉或外周神经阻滞中，特别是老年患者和伴有心脏病的患者发生局麻药误入血管时，曾有心脏停搏的报道。发生心脏停搏时，为了提高复苏成功率，应该延长复苏时间。(7) 硬膜外麻醉会产生低血压和心动过缓。如预先输注扩容药或使用血管加压药物，可减少这一副作用的发生。

【禁忌证】对本品或同类药物过敏者。

【不良反应】最常见的不良反应为低血压和恶心。除此之外，临床报道常见的不良反应（> 1%）是心动过缓、呕吐、感觉异常、体温升高、头痛、尿潴留、头晕、高血压、寒战、心动过速、焦虑、感觉减退。总的来说，本品严重不良反应几乎是少见的。只有在过大剂量或意外将药物注入血管内而使药物血浆浓度骤然上升或者是药物过量的情况下，本品才会造成急性毒性反应。

【用法与用量】用氯化钠注射液按所需给药浓度溶解后使用。常用麻醉的参考剂量，见表17-7，或遵医嘱。一般情况，外科麻醉（如硬膜外用药）需要较高的浓度和剂量。对于镇痛用药（如硬膜外用药）控制急性疼痛，建议使用较低的浓度和剂量。表17-7中的剂量对提供有效的麻醉是必要的，可以作为用于成人的指导剂量。起效时间和持续时间会有个体差异。以上数据反映了所需平均剂量的范围。有关其他局麻技术，应参考标准教科书。(1) 在注射前以及注射期间，应仔细回吸以防止血管内注射。当需要大剂量注射时，如硬膜外麻醉，建议使用3 ~ 5 ml试验剂量的含有肾上腺素的利多卡因（2%利多卡因）。如误静脉内注射可引起短暂的心率加快，或误蛛网膜下腔注射可出现脊髓麻醉。在注入标准剂量前及注入中需反复回吸并注意缓慢注射或逐渐增加注射速度（每分钟25 ~ 50 mg），同时密切观察患者的生命指征并持续与患者交谈。如出现中毒症状，应立即停止注射。硬膜外阻滞中，罗哌卡因单次最高250 mg的剂量曾被使用过，且耐受良好。当需要延长麻醉时，无论持续注入或重复单次注射都应考虑达到血浆中毒浓度或诱发局部神经损伤的危险，手术麻醉当累积剂量达到800 mg时，或术后24小时用于镇痛时，对于成人来说都可以耐受。(2) 对术后疼痛的治疗，建议采用以下技术：如果术前已经放置硬膜外导管，术中可经此管给予本品7.5 mg/ml实施硬膜外注射。术后用2 mg/ml盐酸罗哌卡因维持镇痛。对大多数中度至重度的术后疼痛，临床研究表明每小时6 ~ 10 ml（12 ~ 20 mg）的输液速度，能够提供有效镇痛，只伴有轻微而非进行性的运动神经阻滞。采用这一技术后，对阿片类药物的需求明显下降。

表 17-7 注射用盐酸罗哌卡因的推荐剂量

	浓度(mg/ml)	容量(ml)	总剂量(mg)	起效时间(分钟)	持续时间(小时)
外科手术麻醉					
腰椎硬膜外给药					
外科手术	7.5	15 ~ 25	113 ~ 118	10 ~ 20	3 ~ 5
	10.0	15 ~ 20	150 ~ 200	10 ~ 20	4 ~ 6
剖宫产术	7.5	15 ~ 20	113 ~ 150	10 ~ 20	3 ~ 5
胸椎硬膜外给药					
术后镇痛	7.5	5 ~ 15	38 ~ 123	10 ~ 20	n/a
区域阻滞（例如末梢神经阻滞和浸润麻醉）	7.5	1 ~ 30	7.5 ~ 225	1 ~ 15	2 ~ 6
急性疼痛控制					
腰椎硬膜外给药					
单次给药量	2.0	10 ~ 20	20 ~ 40	10 ~ 15	0.5 ~ 1.5
追加剂量（足量）（如分娩镇痛）	2.0	10 ~ 15	20 ~ 30（最小间隔 30 分钟）		
腰椎硬膜外给药					
持续滴注（如分娩镇痛和术后镇痛）	2.0	每小时 6 ~ 14 ml	每小时 12 ~ 28 mg	n/a	n/a
胸椎硬膜外给药					
持续滴注(如术后镇痛)	2.0	每小时 4 ~ 8 ml	每小时 8 ~ 16 mg	n/a	n/a
区域阻滞（如末梢神经阻滞和浸润麻醉）	2.0	1 ~ 100	2 ~ 200	1 ~ 5	2 ~ 6

n/a. 表示尚缺乏资料

临床研究还表明，对于需用较高剂量的患者，每小时 12 ~ 14 ml（24 ~ 28 mg）的输注速度也能较好地耐受。(3)7.5 mg/ml 以上的浓度曾有用于剖宫产术的记录。

【制剂与规格】盐酸罗哌卡因注射液：① 10 ml ：20 mg；② 10 ml ：75 mg；③ 10 ml ：100 mg；④ 20 ml ：40 mg；⑤20 ml：150 mg；⑥ 20 ml ：200 mg。

丁卡因 [保(甲)]

Tetracaine

【适应证】用于硬膜外阻滞、蛛网膜下腔阻滞、神经传导阻滞、黏膜表面麻醉。

【注意事项】(1) 本品为酯类局麻药，与普鲁卡因可能有交叉过敏反应，故对普鲁卡因或具有对氨基苯甲酸结构的药物过敏者慎用。(2) 肝功能不全，血浆胆碱酯酶活性减弱时应减量。(3) 妊娠期妇女使用局部麻醉药做硬膜外阻滞时用量需减少。(4) 对于哺乳期妇女，尚未见药物进入乳汁的报道。(5) 以下情况慎用：5 岁以内儿童慎用。皮肤或黏膜表面损伤、感染严重的部位需慎用。(6) 大剂量可致心脏传导系统和中枢神经系统出现抑制。(7) 药液不得注入血管内，注射时需反复抽吸，不可有回血。(8) 对儿童、年老体弱、营养不良、饥饿状态易出现毒性反应，应减量。(9) 椎管内麻醉时尤其须调节阻滞平面，并随时观察血压和脉搏的变化。(10) 神经传导阻滞、硬膜外阻滞以及蛛网膜下腔阻滞时，由于使用不当致死非罕见；故在用药期间即使表面黏膜麻醉也应监测呼吸与循环系统的功能、中枢神经活动、胎儿心率等生命体征。同时对呼吸和循环等方面的意外，应有预见，观察细心，防治得法，抢救及时。(11) 本品的毒性

与给药途径、给药速度、药液浓度、注射部位、是否加入肾上腺素等有关，必须严格操作和管理，控制单位时间内的用量。(12) 给予最大用量后应休息3小时以上方准行动。(13) 注射器械不可用碱性物质如肥皂，煤酚皂溶液等洗涤消毒。(14) 本品禁止静脉注射和静脉滴注。

【禁忌证】(1)对本品过敏者、严重过敏性体质者，心、肾功能不全以及重症肌无力等患者。(2)禁止用于浸润局麻。

【不良反应】(1) 毒性反应：本品药效强度为普鲁卡因的10倍，毒性也比普鲁卡因高10倍，毒性反应发生率也比普鲁卡因高，常由于剂量大、吸收快或操作不当引起，如误注入血管使血药浓度过高等。过量中毒症状表现为头晕、目眩、继之寒战、震颤、恐慌、最后可致惊厥和昏迷，并出现呼吸衰竭和血压下降，需及时抢救。(2) 变态反应：对过敏患者可引起猝死，即使表面麻醉时也需注意。(3) 可产生皮疹或荨麻疹，颜、口或（和）舌咽区水肿等。

【用法与用量】本品为粉针剂，需加氯化钠注射液或灭菌注射用水溶解使用。药液浓度及用量按用途分别如下：(1) 硬膜外阻滞：常用浓度为0.15% ~ 0.3%溶液，与盐酸利多卡因合用，最高浓度为0.3%，一次常用量为40 ~ 50 mg，极量为80 mg。(2) 蛛网膜下腔阻滞：常用其混合液（1%盐酸丁卡因1 ml与10%葡萄糖注射液1 ml、3%盐酸麻黄碱1 ml混合使用），一次常用量为10 mg，15 mg为限量，20 mg为极量。(3) 神经传导阻滞：常用浓度0.1% ~ 0.2%，一次常用量为40 ~ 50 mg，极量为100 mg。(4) 黏膜表面麻醉：常用浓度1%，眼科用1%等渗溶液，耳鼻喉科用1% ~ 2%溶液，一次限量为40 mg。

【制剂与规格】注射用盐酸丁卡因：① 10mg；② 15 mg；③ 20 mg；④ 50 mg。

盐酸丁卡因注射液：①3 ml : 30 mg；②5 ml : 50 mg；③ 10 ml : 30 mg。

17.4 疼痛治疗及其用药

疼痛治疗除术后镇痛外，还包括骨关节痛、神经病理性痛和癌性痛的治疗以及胃肠镜无痛、人流无痛和分娩镇痛等。疼痛治疗主要是使用非甾体抗炎药（NSAIDs）、弱阿片类药物、强阿片类药物和辅助药物治疗，强阿片类药物的新剂型或复合剂型正在成为慢性非癌性疼痛和癌性疼痛治疗中的主要药物。

阿片类药物一般为国家特殊管理的麻醉药品，须注意以下几点：(1) 严格遵守国家对麻醉药品的管理条例，处方颜色应与其他药处方区别开。(2) 根据WHO《癌症疼痛三阶梯止痛治疗指导原则》中关于癌症疼痛治疗用药个体化的规定。(3) 注意其可能被患有隐性或显性成瘾性的人寻求和滥用。

辅助用药中，三环类抗抑郁药如阿米替林、马普替林，以及多塞平常用于神经性病理性疼痛的辅助治疗。

疼痛治疗的目的是最大限度地控制疼痛，伴随最轻的不良反应，获得最好的生理和心理功能，最佳的生活质量。

17.4.1 癌症患者止痛的三阶梯治疗

癌症疼痛是一个普遍性的问题，有效的止痛治疗是世界卫生组织癌症综合规划四项重点之一。1982年世界卫生组织为实现“到2000年让癌症患者不痛，并提高其生活质量”的目标，在全球推行癌痛治疗计划。卫生部于1991年下达了关于我国开展“癌症患者三级止痛阶梯治疗方案”工作的通知，以及镇痛药临床应用的五项基本原则。

所谓癌痛治疗的三阶梯方法就是在对癌痛的性质和原因做出正确的评估后，根据患者的疼痛程度和原因适当地选择不同作用强度的镇痛药。第一阶梯的药物为非甾体抗炎药，代表药物为阿司匹林，其他药物有对乙酰氨基酚、布洛芬、双氯芬酸、高乌甲素、萘普生及吲哚美辛栓（肛内）等。这类药物主要用于轻、中度疼痛的患者，也可作为第二、第三阶梯的辅助用药。第二阶梯的药物为弱阿片类镇痛药，代表药物为可待因，其他药物有双氢可待因、氨酚待因、氢可酮、羟考酮、布桂嗪、曲马多等。这类药物主要用于中度疼痛的患者或第一阶梯用药后仍有疼痛的患者。第三

阶梯的药物为强效阿片类镇痛药，代表药物为吗啡，其他药物有氢吗啡酮、羟吗啡酮、左啡诺、二氢埃托啡、美沙酮、芬太尼等。这类药物主要用于重度疼痛的患者或应用了第二阶梯的药物后疼痛仍不能缓解的患者。

（1）癌症疼痛药物治疗的主要原则

①口服给药：首选口服给药，口服给药经济、方便，尤其对强效阿片类镇痛药不易产生依赖性，这样便于患者长期用药。若不适合口服给药或达不到止痛效果，可采用透皮贴剂、肛门给药和输液泵连续皮下用药。②按时给药：以往强调按照药物的有效作用时间有规律地按时给药，而不是按需给药，而现在更主张对持续疼痛给予控缓释药物，对暴发痛临时加用起效快、作用强的速释药物。③按阶梯给药：以往三阶梯原则强调按阶梯给药，而现在更主张选择药物的原则是达到最大的镇痛效应、最小的副作用、最好的功能、最高的生活质量。④个体化用药：所用药物剂量是应以能使患者达到有效镇痛为准，不应以各种镇痛药物推荐的常规剂量为标准，也不受药典中规定的“极量”的限制。一方面因为药物作用存在个体差异；另外，在长期使用阿片类药物的过程中，每个人的耐受情况不同，调整剂量也会有区别。⑤注意其他问题的处理：癌痛患者在治疗过程中，较常出现的问题，如失眠、抑郁；各种镇痛药的不良反应；支持治疗等，要做适当处理。

（2）几个需要说明的问题

①患者对阿片类药物产生了耐受性或生理依赖性，并不等于已经成瘾。患者长期服用阿片类药物，可能出现耐受性或生理依赖性，人们常常错误地把这些反应归类于药物滥用所引起的那种精神依赖性（成瘾）。这种错误的观点，往往导致医生不能正确地将阿片类药物用于控制癌痛。其实，临床用于控制癌痛的阿片类药物，主要采用控、缓释制剂，口服或透皮给药，按时用药，这些方法可以避免出现过高的峰值血药浓度，遵循规范化的治疗，发生药物依赖（成瘾）的危险性也是极小的。药物耐受性在癌痛治疗中普遍存在，不影响患者继续使用阿片类镇痛药。根据病情需要增加阿片类药物的剂量是必要的。

②哌替啶的使用：哌替啶用于急性疼痛及短期止痛的治疗，一般不用于癌性疼痛。这是因为一方面它的镇痛作用持续时间短（2.5 ~ 3.5 小时）；另一方面是其毒性代谢产物去甲哌替啶容易在体内蓄积，从而引起中枢神经系统中毒症状，如癫痫发作、抽搐，肾功能不良时更易产生中毒症状。

③阿片类药物临床应用注意事项：出现中度以上疼痛应早期应用，用足剂量，经常根据病情调整剂量。应用阿片类药物同时应重视不良反应的预防。疼痛加剧时要增加单次用药剂量，而不要增加给药次数。接受即释吗啡治疗者可于睡前将剂量加倍，以防疼痛干扰睡眠。控释片不可碾碎服用。应用阿片类药物治疗时，应有疼痛强度及剂量滴定的纪录。

④控、缓释制剂。吗啡控释片，作用持续 8 ~ 12 小时。长效芬太尼贴剂：经皮肤给药，药物吸收不经胃肠道，避免首关效应，生物利用度高，减少肝脏的不良反应。药物作用持续时间长（2 ~ 3 日），减少给药次数，提高患者依从性，且不易产生耐受性。药物缓慢、平稳释放，血药浓度低，不易达到峰值，不易造成滥用。透皮贴剂使用中应注意以下问题：用药部位为前胸、后背、上臂、大腿内侧；贴药后应按压 30 秒；贴药前用药部位用清水擦洗干净，不宜用可使膜变性的乙醇；贴剂用药后 6 ~ 12 小时起效，用药第 1 日应用速释剂；

⑤减少药物耐受性的方法：尽可能综合应用辅助药加强镇痛效果；交替应用不同类型的镇痛药，而不要自始至终单用一种药物；患者疼痛减轻后，药物剂量可在数日后逐渐调整，用药间隔时间也可适当延长；配合其他止痛方法和给药途径。

⑥癌痛三阶梯治疗的新理念。WHO 提出的 2000 年癌症患者无痛的目标未能实现，主要的原因是癌痛的机制非常复杂，单纯使用药物治疗有一定的局限性。因此，国内外学者倡导调整三阶梯治疗癌痛的理念。按 WHO 阶梯化分方案，归类为第一、二阶梯的患者，目前新的观点是及早采用小剂量的强阿片类药物控制中度疼痛。归

类为第二、三阶梯的患者，疼痛机制更为复杂，部分还涉及神经和组织器官的损害，尤其是神经源性疼痛的患者。目前新的进展是规范和足量使用阿片类镇痛药后，采用辅助用药，其中抗抑郁和抗惊厥类药物的研究是重点。由于癌痛药物治疗的局限性，最后还会有 10% ~ 20% 的患者，在接受规范化的镇痛治疗后不能使疼痛得到有效的控制。对这些患者可考虑采用微创治疗，如神经阻滞、神经损毁及病灶局部治疗等。但这类手术可能引起相应的神经功能障碍，且后期有失效的可能。因此，在临床上适合这些治疗的患者较少。目前国际上公认的比较先进的介入治疗方法是鞘内药物输注治疗，其作用原理是通过埋藏在体内的电脑输注泵，将止痛药物输注至蛛网膜下腔，作用于脊髓的作用位点达到止痛的目的。它不仅能更有效地缓解疼痛，还可以减轻吗啡等药物的不良反应，改善癌症患者的生活质量。

（3）疼痛的评估：癌痛治疗失败的主要原因，往往是因为未能正确评估患者的疼痛情况。评估疼痛需要临床医生和患者的密切配合。治疗开始后，要有规律地定时评估疼痛情况。出现新的疼痛病变时，应随时报告。依据不同的癌痛治疗方案，确定评估疼痛的间隔时间。如非肠道给药法应在用药后 15 ~ 30 分钟开始评估；口服给药法则应在服药后 1 小时开始评估。

判断疼痛的原因，决定疼痛治疗方案。①治疗前评估：其目的在于了解患者疼痛部位、程度、原因等疼痛性质。评估包括以下内容：详细了解病史；体格检查；社会心理学评估；明确诊断。②治疗过程中的评估：在疼痛治疗过程中，需要不断评估疼痛情况。当疼痛发生变化或出现新的疼痛病变时，应及时作出诊断，并修改疼痛治疗计划。③镇痛观察，见表 17-8。

17.4.2 镇痛用药

镇痛药（analgesics）主要作用于中枢神经系统，能选择性地减轻或缓解疼痛感觉，又能使因剧烈疼痛而引起的恐惧、紧张、焦虑不安等不愉快的情绪得到缓解。临床常用的镇痛药有：非甾体抗炎药，用于轻、中度疼痛；阿片类镇痛药及其代用品，用于中、重度疼痛。近年来，强阿片类药物新剂型（缓、控释片剂，透皮贴剂、舌下含片等）或阿片类与非甾体抗炎药复合剂型，正在成为慢性非癌性的或癌性的疼痛治疗中方便而有效的药物。

17.4.2.1 非甾体抗炎药

该类药物品种很多，临床应用的有：阿司匹林、对乙酰氨基酚、布洛芬、双氯芬酸、萘普生、吲哚美辛、萘丁美酮、尼美舒利、洛索洛芬、氟比洛芬、吡罗昔康、美洛昔康、氯诺昔康、塞来昔布、帕瑞昔布等。

洛索洛芬[保(乙)] 用于：①类风湿关节炎、骨关节炎、腰肌劳损、肩关节周围炎、颈肩腕综合征等疾病的消炎和镇痛；②手术后，外伤后及拔牙后的镇痛和消炎；③急性上呼吸道炎（包括伴有急性支气管炎的急性上呼吸道炎）的解热和镇痛。用法：（1）用于适应证①或②时，成人一次 60 mg，一日 3 次。出现症状时，可 1 次口服 60 ~ 120 mg，应随年龄及症状适宜增减或遵医嘱。（2）用于适应证③时，成人一次顿服 60 mg，应随年龄及症状适宜增减。但原则上一日 2 次，每日最大剂量不超过 180 mg，或遵医嘱（其他见 7.1.2.1）。

氟比洛芬[保(乙)]

Flurbiprofen

【适应证】术后及癌症的镇痛。

【注意事项】（1）妊娠妇女应用的安全性尚未确立，妊娠或可能妊娠的妇女必须在治疗的有益性大于危险性时才能应用；尽量不在妊娠末期应用（动物实验中发现在妊娠末期的大鼠用药后可导致分娩延迟及胎儿的动脉导管收缩）。（2）应用本品过程中避免哺乳（可能会分泌到母乳中）。（3）以下情况慎用：有消化道溃疡既往史的患者，有出血倾向、血液系统异常或有既往史的患者，心、肝、肾功能不全或有既往史的患者及高血压患者，有过敏史的患者，有支气管哮喘的患者。（4）儿童使用的安全性尚未确定，因此儿童不宜使用。（5）要特别注意老年患者出

表 17-8 镇痛观察表（需逐项填写）

用药名称：	每次剂量：	给药方式：	按时给药 / Prn：

给药前疼痛程度：（可由患者自己划写，或由主管医护人员划写）

无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

注：0 为无痛，＞ 0 ～ 3 为轻痛，＞ 3 ～ 7 为中度痛，＞ 7 ～ 9 为重度痛，10 为极度疼痛

给药后疼痛程度及其变化：（划线法同上）

给药后 0.5 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 1 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 2 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 3 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 4 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 5 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 6 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后 7 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后≥ 8 ～ 10 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后＞ 10 ～ 12 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后＞ 12 ～ 18 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

给药后＞ 18 ～ 24 小时：
无痛 0 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 极度疼痛

现不良反应，要从小剂量开始慎重给药。(6) 尽量避免与其他的非甾体抗炎药合用。(7) 不能用于发热患者的解热和腰痛症患者的镇痛。(8) 本品的给药途径为静脉注射，不可以肌内注射。(9) 本品应避免长期使用，在不得已需长期使用时，要定期监测血尿常规和肝功能，及时发现异常情况，给予减量或停药。(10) 在用药过程中要密切注意患者的情况，及时发现不良反应，并作适当的处理。

【禁忌证】消化道溃疡患者，严重的肝、肾及血液系统功能障碍患者，严重的心力衰竭、高血压患者，对本制剂成分有过敏史的患者，阿司匹林哮喘或有既往史的患者，正在使用依洛沙星、洛美沙星、诺氟沙星的患者。

【不良反应】(1) 严重不良反应：罕见休克、急性肾衰竭、肾病综合征、胃肠道出血、伴意识障碍的抽搐。(2) 在氟比洛芬的其他制剂的研究中还观察到以下严重不良反应：罕见再生障碍性贫血、中毒性表皮坏死症（Lyell 综合征）、剥脱性皮炎。(3) 一般的不良反应注射部位：偶见注射部位疼痛及皮下出血；消化系统：有时出现恶心、呕吐，转氨酶升高，偶见腹泻，罕见胃肠出血；精神和神经系统：有时出现发热，偶见头痛、倦怠、嗜睡、畏寒；循环系统：偶见血压上升、心悸；皮肤：偶见瘙痒、皮疹等过敏反应；血液系统：罕见血小板减少，血小板功能低下。

【用法与用量】通常成人每次静脉给予氟比洛芬酯 50 mg，尽可能缓慢给药（1

分钟以上)，根据需要使用镇痛泵，必要时可重复应用。并根据年龄、症状适当增减用量。一般情况下，本品应在不能口服药物或口服药物效果不理想时应用。

【制剂与规格】氟比洛芬酯注射液：5 ml : 50 mg。

氯诺昔康[保(乙)] 急性轻度至中度疼痛和由某些类型的风湿性疾病引起的关节疼痛和炎症。用量：(1) 急性轻度或中度疼痛：每日 8 ~ 16 mg。如需反复用药，每日最大剂量为 16 mg。(2) 风湿性疾病引起的关节疼痛和炎症：每日剂量为 12 ~ 16 mg。(其他见 7.1.2.1)

帕瑞昔布[保(乙)]

Parecoxib

【适应证】用于手术后疼痛的短期治疗。在决定使用选择性 COX-2 抑制药前，应评估患者的整体风险。

【注意事项】(1) 轻度肝功能损伤的患者 (Child-Pugh 评分：5 ~ 6) 不必进行剂量调整。中度肝功能损伤的患者 (Child-Pugh 评分：7 ~ 9) 应慎用本品，剂量应减至常规推荐剂量的一半且每日最高剂量降至 40 mg。目前尚无严重肝功能损伤患者 (Child-Pugh 评分：≥ 10) 的临床用药经验，因此禁用于本类患者。(2) 不必对轻度至中度 (肌酐清除率：30 ~ 80 ml/min) 或重度 (肌酐清除率：< 30 ml/min) 肾功能损伤的患者进行剂量调整。但肾功能损伤的患者以及具有液体潴留倾向的患者用药时应密切观察。(3) 妊娠期妇女，除非必需，否则不推荐在妊娠期前 2/3 阶段或分娩期使用本品。(4) 哺乳期妇女不宜使用本品。(5) 以下情况慎用：具有发生心血管事件的高危因素者 (如：高血压、高血脂、糖尿病、吸烟)、老年人、服用其他非甾体抗炎药或阿司匹林或有过胃肠道疾病病史者 (如溃疡或胃肠道出血)、脱水患者、口服华法林或其他口服抗凝血药者。(6) 儿童不推荐使用。(7) 由于应用本品超过 3 天的临床经验有限，建议临床连续使用不超过 3 天。(8) 由于选择性 COX-2 抑制药缺少抗血小板聚集作用，故本品不可替代阿司匹林用于预防心血管血栓栓塞类疾病，治疗期间不能中止抗血小板治疗。

【禁忌证】对本品有过敏史者；有严重药物过敏史，尤其是皮肤反应，如皮肤 - 黏膜 - 眼综合征 (Stevens-Johnson 综合征)、中毒性表皮坏死松解症，多形性红斑等，或已知对磺胺类药物超敏者；活动性消化道溃疡或胃肠道出血；支气管痉挛、急性鼻炎、鼻息肉、血管神经性水肿、荨麻疹以及服用阿司匹林或非甾体抗炎药 (包括 COX-2 抑制药) 后出现其他过敏反应的患者；处于妊娠后 1/3 孕程或正在哺乳者；严重肝功能损伤 (血清白蛋白 < 25 g/L 或 Child-Pugh 评分 ≥ 10)；炎症性肠病；充血性心力衰竭(NYHA Ⅱ - Ⅲ)；冠状动脉旁路移植术后用于治疗术后疼痛；已确定的缺血性心脏疾病，外周动脉血管和 (或) 脑血管疾病。

【不良反应】(1) 常见：术后贫血、低钾血症、焦虑，失眠、感觉减退、高血压，低血压、呼吸功能不全、咽炎、眼干燥症，消化不良，胃肠气胀、瘙痒、背痛、少尿、外周水肿、肌酐升高。(2) 少见：胸骨伤口异常浆液状引流物，伤口感染、血小板减少、脑血管疾病、心动过缓、高血压加重、胃及十二指肠溃疡、瘀斑、ALT 和 AST 升高，血液尿素氮升高。(3) 罕见：急性肾衰竭、心肌梗死、充血性心力衰竭、腹痛、恶心、呕吐、呼吸困难、心动过速和皮肤 - 黏膜 - 眼综合征 (Stevens-Johnson 综合征)。(4) 非常罕见：多样型红斑，剥脱性皮炎及超敏反应 (包括过敏反应和血管性水肿)。

【用法与用量】(1) 静脉或肌内注射推荐剂量为 40 mg，随后视需要间隔 6 ~ 12 小时给予 20 mg 或 40 mg，每天总剂量不超过 80 mg。可直接进行快速静脉注射，或通过已有静脉通路给药。肌内注射应选择深部肌肉缓慢注射。疗程不超过 3 日。(2) 本品可使用氯化钠溶液 (0.9%)、葡萄糖注射液 (5%)、氯化钠 (0.45%) 和葡萄糖 (5%) 注射液作为溶媒。(3) 对于老年患者 (≥ 65 岁) 不必进行剂量调整。但是，对于体重低于 50 kg 的老年患者，本品的初始剂量应减至常规推荐剂量的一半且每日最高剂量应减至 40 mg。

(4) 肝、肾功能损伤者：对于轻度肝功能损伤者不必调整剂量。中度肝功能损伤者应慎用，剂量应减至常规用量的一半，且每日最高剂量降至 40 mg。对肾功能损伤者不必调整剂量，但对肾功能损伤的患者以及有体液潴留倾向的患者应密切观察。

【制剂与规格】注射用帕瑞昔布钠：① 20 mg；② 40 mg（以帕瑞昔布钠计）。

吡罗昔康[保(乙)]

Piroxicam

【适应证】用于缓解各种关节炎及软组织病变的疼痛和肿胀的对症治疗。

【注意事项】(1) 交叉过敏。对阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏的患者，对本品也可能过敏。(2) 餐后给药或与食物或抗酸药同服，以减少胃肠刺激。(3) 一日量超过 20 mg 时，发生胃肠溃疡的危险明显增加。(4) 一般在用药开始后 7 ~ 12 日，还难以达到稳定的血药浓度，因此，疗效的评定常须在用药 2 周后。(5) 用药期间如出现变态反应、血常规异常、视物模糊、精神症状、水潴留及严重胃肠反应时，应即停药。(6) 过量中毒时应即行催吐或洗胃，并进行支持和对症治疗。(7) 下列情况应慎用：①有凝血机制或血小板功能障碍时；②哮喘；③心功能不全或高血压；④肾功能不全；⑤老年患者。(8) 长期用药者应定期复查肝肾功能及血常规。(9) 本品为对症治疗药物，必须同时进行病因治疗。(10)能抑制血小板聚集，作用比阿司匹林弱，但可持续到停药后 2 周。术前和术后应停用。(11) 本品可引起乳汁分泌减少，与用药量有关，哺乳期妇女不宜用。老年患者慎用。

【禁忌证】对本品过敏、消化性溃疡、慢性胃病患者、儿童、孕妇禁用。

【不良反应】(1) 恶心、胃痛、食欲缺乏及消化不良等胃肠不良反应最为常见，其中 3.5% 需为此撤药。服药量大于一日 20 mg 时胃溃疡发生率明显增高，有的合并出血，甚至穿孔。(2) 中性粒细胞减少、嗜酸粒细胞增多、血尿素氮增高、头晕、眩晕、耳鸣、头痛、全身无力、水肿，皮疹或瘙痒等。(3) 肝功能异常、血小板减少、多汗、皮肤瘀斑、脱皮、多形性红斑、中毒性上皮坏死、大疱性多形红斑 (Stevens-Johnson 综合征)，皮肤对光过敏反应、视物模糊、眼部红肿、高血压、血尿、低血糖，精神抑郁，失眠及精神紧张等。

【用法与用量】(1) 口服：成人常用量，一次 20 mg，一日 1 次，或一次 10 mg，一日 2 次。餐后服用。(2)肌内注射：一次 10 ~ 20 mg，一日 1 次。(3) 外用：适量涂于患处。

【制剂与规格】吡罗昔康片：① 10 mg；② 20 mg。

吡罗昔康胶囊：① 10 mg；② 20 mg。

吡罗昔康注射液：① 1 ml ∶ 10 mg；② 2 ml ∶ 20 mg。

吡罗昔康凝胶：① 10 g ∶ 50 mg；② 12 g ∶ 60 mg。

吡罗昔康搽剂：50 ml ∶ 0.5 g。

吡罗昔康软膏：10 g ∶ 0.1 g。

醋氯芬酸[保(乙)]

Aceclofenac

【适应证】骨关节炎、类风湿关节炎、强直性脊柱炎、风湿性关节炎、慢性多发性关节炎、进行性骨关节炎等引起的疼痛和炎症的症状治疗。

【注意事项】(1) 有胃肠道疾病的患者、脑血管出血、溃疡性结肠炎、克罗恩病、系统性红斑狼疮 (SLE)、卟啉病及造血和凝血障碍病史者应慎用或在密切监控下使用。(2) 轻中度肝、肾、心功能不全者及有体液潴留倾向的患者应慎用，这些患者使用 NSAIDS，可导致肾衰竭和体液潴留，用利尿药治疗或其他同样有低血容量危险的患者也应慎用。(3) 在治疗期间，很多时候患者无前兆症状或明显的病史，结果出现严重的胃肠出血和(或)穿孔。(4) 老年患者可能造成肾、心血管和肝功能损害，应慎用。(5) 长期使用 NSAIDs 治疗的患者应经常检查以作预防（如肝、肾功能和血细胞计数）。(6) 服用 NSAIDs 出现头晕和中枢神经系统其他障碍的患者应避免驾驶和从事机械操作。(7) 醋氯芬酸能否分泌到乳汁中尚不清楚，因此哺乳期间不应使用。(8) 不推荐儿童使用。

【禁忌证】已知对醋氯芬酸及其他非

甾体药物过敏者禁用。患者服用作用机制类似的药物（如阿司匹林或其他非甾体抗炎药），引起哮喘、支气管痉挛、急性鼻炎或荨麻疹或已知对抗炎类药物过敏者禁用。患有严重心衰、肝肾功能不全者禁用。患有或者怀疑患有胃及十二指肠溃疡或者胃及十二指肠溃疡复发史的患者，胃肠道出血或其他出血或凝血障碍患者禁用。在妊娠期后 3 个月，孕妇禁用。

【不良反应】常见胃肠道不良反应（消化不良、腹痛、恶心和腹泻）。

【用法与用量】口服：成人，一次 100 mg，一日 2 次或遵医嘱。一日推荐最大剂量为 400 mg。具有轻中度肝功能不全的患者应减少剂量，推荐初始剂量为一日 100 mg。轻中度肾功能不全患者无须调整剂量，但应慎用。

【制剂与规格】醋氯芬酸胶囊：100 mg。

氟比洛芬酯[保(乙)]

Flurbiprofen Axetil

【适应证】术后及癌症的镇痛。

【注意事项】(1) 下述患者慎用本药：①有消化道溃疡既往史的患者；②有出血倾向、血液系统异常或有既往史的患者；③心、肝、肾功能不全或有既往史的患者；④有过敏史的患者；⑤有支气管哮喘的患者。(2) 尽量避免与其他的非甾体抗炎药合用。(3) 不能用于发热患者的解热和腰痛症患者的镇痛。(4) 本品的给药途径为静脉注射，不可以肌内注射。(5) 不能经口服药的患者如能口服药物时，应停止静脉给药，改为口服给药。(6) 本品应避免长期使用，在不得已需长期使用时，要定期监测血、尿常规和肝功能，及时发现异常情况，给予减量或停药。 (7) 在用药过程中要密切注意患者的情况，及时发现不良反应，并作适当的处理。(8) 妊娠妇女应用的安全性尚未确立，妊娠或可能妊娠的妇女必须在治疗的有益性大于危险性时才能应用；尽量不在妊娠末期应用（动物实验中发现在妊娠末期的大鼠用药后可导致分娩延迟及胎儿的动脉导管收缩）。(9) 应用本品过程中应避免哺乳（可能会转移到母乳中）。(10) 儿童使用的安全性尚未确定，因此儿童不宜使用。(11) 要特别当心老年患者出现不良反应，应从小剂量开始慎重给药。

【禁忌证】(1) 消化道溃疡患者。(2) 严重的肝、肾及血液系统功能障碍患者。(3) 严重的心力衰竭、高血压患者。(4) 对本制剂成分有过敏史的患者。(5) 阿司匹林哮喘，或有既往史的患者。(6) 正在使用依洛沙星、洛美沙星、诺氟沙星的患者。

【不良反应】(1) 严重不良反应：罕见休克、急性肾衰竭、肾病综合征、胃肠道出血、伴意识障碍的抽搐。(2) 在氟比洛芬其他制剂的研究中还观察到以下严重不良反应：罕见再生障碍性贫血、中毒性表皮坏死症（Lyell 综合征）、剥脱性皮炎。(3) 一般的不良反应：有时出现恶心、呕吐、肝酶升高、发热；偶见注射部位疼痛及皮下出血、腹泻、头痛、倦怠、嗜睡、畏寒、血压上升、心悸、瘙痒、皮疹等变态反应；罕见胃肠出血、血小板减少、血小板功能低下。

【用法与用量】成人每次静脉给予氟比洛芬酯 50 mg，尽可能缓慢给药（1 分钟以上）。根据需要使用镇痛泵，必要时可重复应用，并根据年龄、症状适当增减用量。一般情况下，本品应在不能口服药物或口服药物效果不理想时应用。

【制剂与规格】氟比洛芬酯注射液：5 ml ∶ 50 mg。

安乃近[保(乙)]

Metamizole

【适应证】用于高热时的解热，也可用于头痛、偏头痛、肌肉痛、关节痛、痛经等。本品亦有较强的抗风湿作用，可用于急性风湿性关节炎，但因本品有可能引起严重的不良反应，很少在风湿性疾病中应用。

【注意事项】(1) 本品与阿司匹林有交叉过敏反应。(2) 本品一般不作首选用药，仅在急性高热、病情急重，又无其他有效解热药可用的情况下用于紧急退热。(3) 本品用药超过 1 周时应定期检查血象，一旦发生粒细胞减少，应立即停药。(4) 安乃近的代谢产物可进入乳汁，孕妇

及哺乳期妇女不宜应用。儿童用药尚不明确。老年人慎用。

【禁忌证】对本品或氨基比林有过敏史者禁用。

【不良反应】本品对胃肠道的刺激虽较小，但可引起以下各种不良反应：①血液方面，可引起粒细胞缺乏症，发生率约1.1%，急性起病，重者有致命危险，亦可引起自身免疫性溶血性贫血、血小板减少性紫癜、再生障碍性贫血等；②皮肤方面，可引起荨麻疹、渗出性红斑等过敏性表现，严重者可发生剥脱性皮炎、表皮松解症等；③个别病例可发生过敏性休克，甚至导致死亡。

【用法与用量】(1) 成人，口服：一次0.25～0.5g，一日0.75～1.25g。(2) 小儿，滴鼻：小儿退热常以10%～20%溶液滴鼻，5岁以下每侧鼻孔一次1～2滴，必要时重复用1次。

【制剂与规格】安乃近片：①0.25g；②0.5g。

安乃近滴鼻液：10%～20%。

赖氨酸阿司匹林(赖氨匹林)[保(乙)]

Lysine Acetylsalicylate

【适应证】用于缓解轻中度疼痛及多种原因引起的发热，并用于类风湿关节炎、骨关节炎等的症状缓解。

【注意事项】(1) 交叉过敏反应。对某一种水杨酸类药物或非甾体抗炎药过敏时也可能对另一种水杨酸类药过敏。但是对本品过敏者不一定对非乙酰化的水杨酸类药过敏。(2) 下列情况时应慎用：①有哮喘及其他过敏性反应时；②溃疡病或腐蚀性胃炎；③葡萄糖6磷酸脱氢酶缺陷者；④痛风(本品可影响其他排尿酸药的作用，小剂量时可能引起尿酸潴留)；⑤肝功能减退时可加重肝脏毒性反应，加重出血倾向，肝功能不全或肝硬化患者易出现肾脏不良反应；⑥心功能不全或高血压，大量应用可能引起心力衰竭或肺水肿。(3) 长期大量用药时应定期检查血细胞比容、肝功能及血清水杨酸含量测定。(4) 小儿患者，尤其是有发热及脱水者，易出现毒性反应。急性发热疾病，尤其是流感及水痘患儿应用本品，可能会发生瑞氏综合征(Reye's syndrome)，因而不推荐使用。(5) 老年患者服用本品易出现毒性反应，故减量服用。

【禁忌证】下列情况应禁用：①活动期溃疡病或其他原因引起的消化道出血；②血友病或血小板减少症；③有阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏史者，尤其是出现哮喘、神经血管性水肿或休克者。④本品易于通过胎盘，妊娠早晚期用药都有致畸作用，长期使用可使产程延长，产后出血增多等，故禁用；也可在乳汁中排泄，长期大剂量用药时婴儿有可能产生不良反应，哺乳期妇女禁用。

【不良反应】一般用于解热镇痛的剂量很少引起不良反应。长期大量用药(治疗风湿热)、尤其当药物血浓度＞200mg/ml时较易出现不良反应。血药浓度愈高，不良反应愈明显。(1) 较常见的有恶心、呕吐、上腹部不适或疼痛等胃肠道反应，停药后多可消失。长期或大剂量服用可有胃肠道出血或溃疡。(2) 中枢神经：出现可逆性耳鸣、听力下降，多在服用一定疗程，药物血浓度达200～300mg/ml后出现。(3) 变态反应：表现为哮喘、荨麻疹、血管神经性水肿或休克。多为易感者，服药后迅速出现呼吸困难，严重者可致死亡，称为阿司匹林哮喘。有的是阿司匹林过敏、哮喘和鼻息肉三联征，往往与遗传和环境因素有关。(4) 肝肾功能损害，与剂量大小有关，尤其是剂量过大使血药浓度达250mg/ml时易发生。损害均是可逆性的，停药后可恢复，但有引起肾乳头坏死的报道。

【用法与用量】口服：本品宜以凉开水溶解后立即服用，开水温度越高，或冲后放置时间越长，易致本品分解为水杨酸。(1) 解热镇痛：一次0.45～0.9g，一日2～3次。(2) 抗风湿：一次0.9～1.8g，一日4次或遵医嘱。

【制剂与规格】赖氨酸阿司匹林散：2g：0.45g。

注射用赖氨酸阿司匹林：①0.5g(相当于阿司匹林0.28g)；②0.9g(相当于阿司匹林0.5g)。

舒林酸[保(乙)]

Sulindac

【适应证】适用于类风湿关节炎、退行性关节病。

【注意事项】(1) 有消化性溃疡史，目前无活动性溃疡的患者需在严密观察下使用本品。(2) 用药期间应定期监测大便隐血、血常规、肝肾功能。(3) 将本品放置于儿童不易接触的地方。(4) 妊娠期及哺乳期妇女不宜服用。2 岁以下儿童不宜服用。有肾功能明显减退，应相应减少服用药剂量。

【禁忌证】(1) 对本品或其他非甾体抗炎药有过敏者禁用。(2) 活动性消化性溃疡者或曾有溃疡出血或穿孔史者禁用。

【不良反应】(1) 常见不良反应为胃肠道反应，包括上腹痛、腹胀、消化不良、恶心、腹泻、便秘、纳差等，发生消化道溃疡者较少。(2) 中枢神经系统症状一般极少发生，主要有头晕、头痛、嗜睡、失眠。(3) 骨髓抑制、急性肾衰竭、心力衰竭、无菌性脑膜炎、肝损害和 Stevens-Johnson 综合征则罕见。(4) 其他：偶见皮疹、瘙痒、急躁、忧郁等。

【用法与用量】口服：①成人常用量：口服，一次 0.2 g，早晚各 1 次；镇痛时可 8 小时后重复。② 2 岁以上儿童，常用量，一次 2.25 mg/kg，一日 2 次，一日剂量不得超过 6 mg/kg。

【制剂与规格】舒林酸片：① 0.1 g；② 0.2 g。

尼美舒利[保(乙)]

Nimesulide

【适应证】可用于慢性关节炎症（如类风湿关节炎和骨关节炎等）；手术和急性创伤后的疼痛；耳鼻咽部炎症引起的疼痛；痛经；上呼吸道感染引起的发热等症状治疗。

【注意事项】(1) 尼美舒利对以下患者要慎重使用：具有出血症病史的患者，具有胃肠道疾病的患者，接受抗凝血剂治疗或是服用抗血小板凝集药物的患者。(2) 对药物胃耐受性差的患者服用本品应被置于严密的观察之下，因本品主要通过肾脏系统排除体外，如果肾功能不全，就必须根据肾小球的渗透值，来减少服药的剂量。如果有用了其他非甾体抗炎药之后，出现视力下降的症状，为了证实视力是否受到影响，最好停止治疗，进行眼科检查。(3) 在尚未通过试验证实尼美舒利对胎儿是否有毒性的情况下，不建议在妊娠期间使用本药。在尚不清楚尼美舒利是否可能通过母乳排除体外的情况下，同样不建议在哺乳期间使用本药。

【禁忌证】对本品、阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏者禁用。正处于肠胃出血的患者或消化道溃疡活动期的患者禁用。严重肾功能不全者禁用。

【不良反应】主要有胃灼热、恶心、胃痛，但症状都轻微、短暂，很少需要中断治疗。极少情况下，患者服药后出现过敏性皮疹。即使使用尼美舒利未产生上述不良反应，也应注意到本品如同其他非甾体抗炎药一样，可能产生头晕、欲睡、胃溃疡或肠胃出血及 Stevens-Johnson 综合征。

【用法与用量】本品仅用于成人。(1) 口服：一次 50 ~ 100 mg，一日 2 次，餐后服用。按照病情的轻重和患者的需要，可以增加到 200 mg，一日 2 次。老年人的服药剂量应严格遵照医生规定，医生可以根据情况适当减少以上所列的剂量。(2) 直肠给药：一次 200 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】尼美舒利片：0.1 g。

尼美舒利栓：0.2 g。

精氨酸布洛芬[保(乙)]

Ibuprofen Arginine

【适应证】适用于牙痛、痛经，因创伤引起的疼痛，关节和韧带痛，背痛，头痛，以及流感引起的发热。

【用法与用量】成人和 12 岁以上患者，通常口服一次剂量为 400 mg，一日 2 ~ 3 次。将药品放入水杯中，加入适量的温水，混合到药液完全溶解后即可服用。空腹服用本品起效更为迅速。一般一日剂量不要超过 1 200 mg。

【制剂与规格】精氨酸布洛芬颗粒：0.4 g。

第 17 章 麻醉用药

去痛片（索米痛）[保（甲）]

Compound Aminopyrine Phenacetin Tablets

【适应证】用于发热及轻、中度的疼痛。

【注意事项】(1) 本品长期服用，可导致肾脏损害，严重者可致肾乳头坏死或尿毒症，甚至可能诱发肾盂癌和膀胱癌。不宜长久使用，以免发生中性粒细胞缺乏，用药超过 1 周要定期检查血象。(2) 氨基比林在胃酸下与食物发生作用，可形成致癌性亚硝基化合物，特别是亚硝胺，因此有潜在的致癌性。(3) 长期服用可造成依赖性，并产生耐受。(4) 对各种创伤性剧痛和内脏平滑肌绞痛无效。

【禁忌证】对氨基比林、非那西丁、咖啡因或苯巴比妥类药物过敏者禁用。

【不良反应】本复方所含氨基比林和非那西丁均有明显不良反应。服用氨基比林可有呕吐、皮疹、发热、大量出汗及发生口腔炎等，少数可致中性粒细胞缺乏、再生障碍性贫血、渗出性红斑、剥脱性皮炎、龟头糜烂等。长期服用非那西丁可引起肾乳头坏死、间质性肾炎并发生急性肾衰竭，甚至可能诱发肾盂癌和膀胱癌，还可造成对药物的依赖性。非那西丁还易使血红蛋白形成高铁血红蛋白，使血液的携氧能力下降，导致发绀，还可引起溶血、肝脏损害，并对视网膜有一定毒性。

【用法与用量】需要时服用，一次 1 ～ 2 片，一日 1 ～ 3 次。

【制剂与规格】去痛片：每片含氨基比林 0.15 g、非那西丁 0.15 g、咖啡因 50 mg、苯巴比妥 15 mg。

氨糖美辛[保（乙）]

Glucosamine Indomethacin

【适应证】消炎镇痛药，临床用于强直性脊柱炎、颈椎病，亦可用于肩周炎、风湿性或类风湿关节炎等。

【注意事项】(1) 本品为肠溶衣片，应整片吞服，以防药物在胃中被破坏。(2) 连续使用 3 天后炎症仍未消除，应向医师咨询。(3) 请将本品放在儿童不能触及的地方，儿童须在成人监护下使用。(4) 当药品形状发生改变时禁止使用。

【禁忌证】肾功能不全、孕妇、从事危险或精细工作人员、精神病、癫痫、活动性胃及十二指肠溃疡患者及小儿禁用。

【不良反应】口服不良反应少。偶见过敏反应。有皮疹等表现。

【用法与用量】口服：一次 1 ～ 2 片，一日 1 ～ 2 次，于进食或饭后即服。

【制剂与规格】氨糖美辛肠溶片：0.1 g。

17.4.2.2 阿片类镇痛药及其代用品

可待因[保（乙）]

Codeine

【适应证】(1) 镇咳，用于较剧的频繁干咳，如痰液量较多宜并用祛痰药。(2) 镇痛，用于中度以上的疼痛。(3) 镇静，用于辅助局麻或全麻。

【注意事项】(1) 本品可透过胎盘使婴儿成瘾，引起新生儿的戒断症状，如：过度啼哭、打喷嚏、打呵气、腹泻、呕吐等，妊娠妇女慎用。分娩应用本品可引起新生儿呼吸抑制。(2) 本品可自乳汁排除，哺乳期妇女慎用。(3) 下列情况应慎用，如支气管哮喘、急腹症；在诊断未明确时，可能因掩盖真相造成误诊；胆结石，可引起胆管痉挛；原因不明的腹泻，可使肠道蠕动减弱、减轻腹泻症状而误诊；颅脑外伤或颅内病变，本品可引起瞳孔变小，模糊临床体征；前列腺肥大病因本品易引起尿潴留而加重病情。(4) 重复给药可产生耐药性，久用有成瘾性，也可引起便秘。(5) 本品为国家特殊管理的麻醉药品，必严格遵守国家对麻醉药品的管理条例使用和管理。(6) 磷酸可待因缓释片必须整片吞服，不可截开或嚼碎。

【禁忌证】对本品过敏的患者；多痰患者，以防因抑制咳嗽反射，使大量痰液阻塞呼吸道，继发感染而加重病情。婴幼儿、未成熟新生儿。

【不良反应】较多见的不良反应有幻想、呼吸微弱／缓慢或不规则、心率或快或慢；少见的不良反应：惊厥、耳鸣、震颤或不能自控的肌肉运动，荨麻疹、瘙痒、皮疹或脸肿等过敏反应；长期应用引起依

赖性，常用量引起依赖性的倾向较其他吗啡类为弱。典型的依赖症状为食欲减退、腹泻、牙痛、恶心呕吐、流涕、寒战、打喷嚏、打哈欠、睡眠障碍、胃痉挛、多汗、衰弱无力、心动过速、情绪激动或原因不明的发热。

【用法与用量】(1) 成人。口服：一次 15 ~ 30 mg，一日 2 ~ 3 次；极量一次 100 mg，一日 250 mg。皮下注射：一次 15 ~ 30 mg（仅供手术中使用）。(2) 儿童：口服①镇痛，一次按体重 0.5 ~ 1 mg/kg，一日 3 次；②镇咳，用量按镇痛量的 1/3 ~ 1/2。

【制剂与规格】磷酸可待因片：① 15 mg；② 30 mg。

磷酸可待因缓释片：① 15 mg；② 30 mg。

磷酸可待因糖浆：① 10 ml；② 100 ml。

磷酸可待因注射液：① 1 ml : 15 mg；② 1 ml : 30 mg。

磷酸可待因 / 双氯芬酸钠复方片（氯芬待因片）：每片含磷酸可待因 15 mg，双氯芬酸钠 25 mg。本品适用于轻至中度疼痛，成人口服：一次 1~2 片，一日 2 ~ 3 次。

洛芬待因（布洛芬可待因）片：每片含布洛芬 0.2 g 与磷酸可待因 12.5 mg。本品为中等强度疼痛止痛，适用于术后痛和中度癌痛止痛。口服：成人首次剂量 2 片。如需再服，每 4 ~ 6 小时 1 ~ 2 片。最大剂量一日 6 片，连续服用不超过 7 日。

磷酸可待因 / 对乙酰氨基酚复方片：该药临床应用较早、较广泛，故另单独叙述。

双氢可待因 [保 (乙)]

Dihydrocodeine

【适应证】用于缓解中度以上疼痛。

【注意事项】(1) 下列情况应慎重使用：①心功能不全者。②呼吸功能不全者。③肝、肾功能不全者。④脑器质性病变者。⑤处于休克状态者。⑥代谢性酸中毒者。⑦甲状腺功能低下者。⑧肾上腺皮质功能低下者。⑨既往有药物依赖史者。⑩老年患者，身体衰弱者，因前列腺肥大所致的排尿不全、尿道狭窄及尿路手术后者，器质性幽门狭窄、麻痹性肠梗阻及近期进行了胃肠道手术者，有抽搐既往史者，胆囊病变及胆结石者，严重的炎性肠道疾病者。(2) 本品长期使用会产生药物依赖性。(3) 使用本品会有困倦、眩晕等发生，因此，驾驶车辆和机械操作者应特别注意。(4) 孕妇及哺乳期妇女不宜使用；12 岁以下儿童不推荐使用或遵医嘱。

【禁忌证】(1) 呼吸抑制。(2) 呼吸道阻塞性疾病。(3) 慢性肺功能障碍者。(4) 因本品可引起组胺释放，支气管哮喘发作时禁用。(5) 诊断不明确的急腹症患者禁用。(6) 休克、昏迷或心力衰竭患者禁用。(7) 对本品中任何成分过敏者禁用。(8) 抽搐状态。(9) 急性酒精中毒。(10) 对阿片类生物碱过敏者。(11) 失血性大肠炎及细菌性痢疾。

【不良反应】主要为便秘、恶心、呕吐、胃部不适、皮肤瘙痒。

【用法与用量】口服：一次 30 ~ 60 mg，一日 3 次或遵医嘱，餐后服用。需依据临床症状调节用量，如全日用量超过 240 mg 镇痛不佳时，请改用更强效的镇痛药。控释片，一次 60 ~ 120 mg，一日 2 次。

【制剂与规格】酒石酸双氢可待因片：30 mg。

酒石酸双氢可待因控释片：60 mg。

氨酚待因片 [保 (乙)]

Paracetamol and Codeine Phosphate Tablets

【适应证】中等强度镇痛药。适用于各种手术后疼痛、骨折、中度癌症疼痛、骨关节疼痛、牙痛、头痛、神经痛、全身痛、软组织损伤及痛经等。

【注意事项】(1) 长期大量应用时，特别是肝功能异常者，应定期测定肝功能及血常规。(2) 下列情况慎用：酒精中毒、肝病或病毒性肝炎、肾功能不全、支气管哮喘、胆结石、颅脑外伤或颅内病变、前列腺肥大、哺乳期妇女及妊娠期妇女、老年患者。(3) 7 岁以下儿童不宜使用。(4) 长期使用后身体可产生一定程度的耐受性。本品属于二类精神药管理。(5) 不明原因的急腹症、腹泻，应用本品后可能掩盖真相造成误诊，故应慎重。

【禁忌证】对本品过敏者，呼吸抑制及有呼吸道梗阻性疾病，尤其是哮喘发作的患者；多痰患者，以防因抑制咳嗽反射，使大量痰液阻塞呼吸道，继发感染而加重病情。

【不良反应】偶有头晕、出汗、恶心、嗜睡等反应，停药后可自行消失。超剂量或长期使用可产生药物依赖性。

【用法与用量】口服：规格分为氨酚待因片（Ⅰ）和（Ⅱ）氨酚待因片。(1) 氨酚待因片（Ⅰ）：①成人，一次 1 ~ 2 片，一日 3 次；中度癌症疼痛一次 2 片，一日 3 次。② 7 ~ 12 岁儿童一次 1/2 ~ 1 片，一日 3 次（一日不超过 2 ~ 4 片）。(2) 氨酚待因片（Ⅱ）：①成人，一次 1 片，一日 3 次，中度癌症疼痛必要时可由医生决定适当增加。② 7 ~ 12 岁儿童按体重相应减量，连续使用一般不超过 5 日。

【制剂与规格】氨酚待因片（Ⅰ）：每片含对乙酰氨基酚 0.5 g、磷酸可待因 8.4 mg。

氨酚待因片（Ⅱ）：每片含对乙酰氨基酚 0.3 g、磷酸可待因 15 mg。

吗啡 [保（甲/乙）]

Morphine

【适应证】本品为强效镇痛药。吗啡注射液及普通片剂用于其他镇痛药无效的急性锐痛，如严重创伤、战伤、烧伤、晚期癌症等疼痛；心肌梗死而血压尚正常者，可使患者镇静，并减轻心脏负担；用于心源性哮喘可使肺水肿症状暂时有所缓解；麻醉和手术前给药可保持患者宁静进入嗜睡；不能单独用于内脏绞痛（如胆绞痛等），而应与阿托品等有效的解痉药合用。吗啡缓、控释片则主要适用于重度癌痛患者镇痛。

【注意事项】(1) 以下情况慎用：①有药物滥用史；②颅内压升高；③低血容量性低血压，④胆道疾病或胰腺炎；⑤老年人；⑥严重肾衰；⑦严重慢性阻塞性肺部疾患；⑧严重肺源性心脏病；⑨严重支气管哮喘或呼吸抑制；⑩婴幼儿（普通片剂及注射液）。(2) 未明确诊断的疼痛，尽可能不用本品，以免掩盖病情，贻误诊断。(3) 可干扰对脑脊液压升高的病因诊断。(4) 本品可能引起胆管系的内压上升，可升高血浆淀粉酶和脂肪酶。(5) 对血清碱性磷酸酶、丙氨酸氨基转移酶、门冬氨酸氨基转移酶、胆红素、乳酸脱氢酶等测定有一定影响，可能出现假阳性。(6) 对有癫痫病史的患者，吗啡可降低癫痫发作的阈值。(7) 吗啡可削弱驾驶和操作机械的能力。(8) 控、缓释片必须整片吞服。(9) 不经胃肠途径滥用口服药物有可能导致严重的不良反应，甚至致死。(10) 本品使用 3 ~ 5 日会产生对药物的耐受性，长期应用可成瘾，治疗突然停止时会发生戒断综合征。本品按麻醉药品严格管理和使用。(11) 对于重度癌痛患者，吗啡使用量不受药典中吗啡极量的限制。(12) 中毒解救除一般中毒处理外，还可静脉注射纳洛酮 0.005 ~ 0.01 mg/kg，成人 0.4 mg。亦可用烯丙吗啡作为拮抗药。

【禁忌证】已知对吗啡过敏者、婴幼儿（缓、控释片）、未成熟新生儿、妊娠期妇女、临盆产妇、哺乳期妇女、呼吸抑制已显示发绀、颅内压增高和颅脑损伤、支气管哮喘、肺源性心脏病代偿失调、甲状腺功能减退、皮质功能不全、前列腺肥大、排尿困难及严重肝功能不全、休克尚未纠正控制前、麻痹性肠梗阻等患者。

【不良反应】(1) 注射剂连续 3 ~ 5 日即产生耐受性，1 周以上可成瘾；但对于晚期中重度癌痛患者，如果治疗适当，少见依赖及成瘾现象。(2) 常见：腹痛，食欲减退，便秘，口干，消化不良，恶心，呕吐，思维混乱，头痛，失眠，肌肉不自主收缩，嗜睡，支气管痉挛，咳嗽减少，皮疹，寒战，瘙痒，出汗。(3) 不常见：肝酶升高，胆部疼痛，胃肠功能紊乱，肠梗阻，味觉反常，兴奋，烦躁不安，欣快，幻觉，不适，情绪改变，感觉异常，呼吸抑制，癫痫发作，眩晕，视觉异常，戒断综合征，绝经，性欲减退，阳痿，尿潴留，低血压，晕厥，外周性水肿，肺水肿，荨麻疹和过敏反应，药物依赖，面部潮红，瞳孔缩小，药物耐受。

【用法与用量】注射：(1) 皮下注射，①成人常用量一次 5 ~ 15 mg，一日 15 ~ 40 mg；②极量：一次 20 mg，一日 60 mg。(2) 成人镇痛时常用静脉注射量：5 ~ 10 mg；用作静脉全麻按体重不得超过

1 mg/kg，不够时加用作用时效短的本类镇痛药，以免苏醒迟延、术后发生血压下降和长时间呼吸抑制。(3) 手术后镇痛注入硬膜外间隙，成人自腰部硬膜外腔注人，一次极限 5 mg，胸部硬膜外腔应减为 2 ~ 3 mg，按一定的间隔可重复给药多次。注入蛛网膜下腔，一次 0.1 ~ 0.3 mg。原则上不再重复给药。(4) 对于重度癌痛患者，首次剂量范围较大，一日 3 ~ 6 次，以预防癌痛发生及充分缓解癌痛。口服：(1) 普通片剂，①常用量：一次 5 ~ 15 mg。一日 15 ~ 60 mg；②极量：一次 30 mg，一日 100 mg。对于重度癌痛患者，首次剂量范围可较大，一日 3 ~ 6 次，临睡前一次剂量可加倍。(2) 缓、控释片，成人常用量，个体差异较大，宜从每 12 小时服用 10 或 20 mg 开始，视止痛效果调整剂量或先用速效吗啡滴定剂量后转换为等效控释片剂量。

【制剂与规格】盐酸吗啡注射液：① 0.5 ml : 5 mg；② 1 ml : 10 mg。

盐酸吗啡片：① 5 mg；② 10 mg；③ 20 mg；④ 30 mg；⑤ 50 mg。

盐酸吗啡缓释片：30 mg。

盐酸吗啡控释片：① 10 mg；② 30 mg；③ 60 mg。

布托啡诺[保(乙)]

Butorphanol

【适应证】用于治疗各种癌性疼痛、手术后疼痛。

【注意事项】(1) 对于重复使用麻醉止痛药，且对阿片耐受的患者慎用。(2) 脑损害和颅内压升高的患者慎用或不用。(3) 肝肾疾病患者初始剂量间隔时间应延长至 6 ~ 8 小时，直至反应很好，随后的剂量随病人反应调整而不是按固定方案给药。(4)对有心肌梗死、心室功能障碍、冠状动脉功能不全的患者慎用。发生高血压时，应立即停药。(5) 本品可致呼吸抑制，尤其是同时服用兴奋 CNS 药或患有 CNS 疾病或呼吸功能缺陷的患者，慎用。(6) 服用本品时，禁止喝酒。(7) 长期、频繁、大量使用酒石酸布托啡诺可能会产生生理依赖性和滥用。(8) 妊娠期妇女最好不要用药，只有潜在利益大于潜在风险时，才可使用本品。哺乳期妇女用药应权衡利弊。(9) 建议老年患者使用布托啡诺时，起始剂量减半，并且比正常人间歇延长 2 倍，随后的剂量和间歇时间根据病人具体反应而定。(10) 因阿片的拮抗特征，本品不宜用于依赖那可汀的患者。

【禁忌证】(1) 对本品或本品中其他成分过敏者禁用。(2) 年龄小于 18 岁患者禁用。

【不良反应】主要为嗜睡、头晕、恶心和（或）呕吐。常见：①全身：虚弱、头痛、热感。②心血管系统：血管舒张、心悸。③消化系统：厌食、便秘、口干、胃痛。④神经系统：焦虑，意识模糊，欣快感，飘浮、失眠、神经质、感觉异常、震颤。⑤呼吸系统：支气管炎、咳嗽、呼吸困难、鼻出血、鼻充血、鼻刺激、咽炎、鼻炎、鼻窦炎、鼻窦充血、上呼吸道感染。⑥皮肤：多汗 / 湿冷，瘙痒。⑦特殊感觉：视物模糊、耳痛、耳鸣、味觉异常。少见：低血压、晕厥、异梦、焦虑、幻觉、戒断症状、皮疹 / 风团、排尿障碍。

【用法与用量】(1) 静脉注射：一次 1 mg。(2) 肌内注射：一次 1 ~ 2 mg。如需要，每 3 ~ 4 小时，可重复给药一次。单剂量不超过 4 mg。

【制剂与规格】酒石酸布托啡诺注射液：1 ml : 1 mg。

美沙酮[保(乙)]

Methadone

【适应证】用于慢性、中度至重度剧烈疼痛和剧烈咳嗽患者，主要用于癌症患者镇痛。

【注意事项】(1) 本品按麻醉药品管理。(2) 本品为阿片或吗啡成瘾者戒断用药，戒断症状轻微，但依赖性显著，一般多采用维持治疗。

【禁忌证】呼吸功能不全者、婴幼儿禁用。妊娠分娩期间严格禁用。

【不良反应】(1) 不良反应主要有性功能减退、男性服用后精液少，且可有乳腺增生。女性与避孕药同用，可终日迷倦乏力，逾量可逐渐进人昏迷，并出现右束支传导阻滞、心动过速和（或）低血压。(2) 亦有眩晕、恶心、呕吐、出汗、嗜睡

等，也可引起便秘及药物依赖。

【用法与用量】(1) 口服：用量约为吗啡剂量的一半，一般起始剂量成人一次 5 ~ 10 mg，对慢性疼痛患者，随着用药时间延长和耐受的形成，应逐渐增加剂量以达有效镇痛效果，或遵医嘱。(2) 肌内或皮下注射：一次 2.5 ~ 5 mg，一日 3 次。极量一次 10 mg，一日 20 mg。

【制剂与规格】盐酸美沙酮片：① 2.5 mg；② 5 mg；③ 10 mg。

盐酸美沙酮注射液：1 ml ∶ 5 mg。

哌替啶[基(基)，保(甲)]

Pethidine

【适应证】本品为强效镇痛药，适用于各种剧痛，如创伤性疼痛、手术后疼痛、麻醉前用药，或局麻与静吸复合麻醉辅助用药等。对内脏绞痛应与阿托品配伍应用。用于分娩镇痛时，须监测本品对新生儿的抑制呼吸作用。麻醉前给药、人工冬眠时，常与氯丙嗪、异丙嗪组成人工冬眠合剂应用。用于心源性哮喘，有利于肺水肿的消除。慢性重度疼痛的晚期癌症患者不宜长期使用本品。

【注意事项】(1) 本品与芬太尼的化学结构有相似之处，两药可有交叉过敏。(2) 妊娠及哺乳：本品能通过胎盘屏障及分泌入乳汁，因此产妇分娩镇痛时以及哺乳期间使用时剂量酌减。(3) 以下情况慎用：老年人、肝功能损伤、甲状腺功能不全者、运动员。(4) 本品为国家特殊管理的麻醉药品，务必严格遵守国家对麻醉药品的管理条例，医院和病室的贮药处均须加锁。处方颜色应与其他药处方区别开。各级负责保管人员均应遵守交接班制度，不可稍有疏忽。(5) 未明确诊断的疼痛，尽可能不用本品，以免掩盖病情贻误诊治。(6) 静脉注射后可出现外周血管扩张，血压下降，尤其与吩噻嗪类药物（如氯丙嗪等）以及中枢抑制药并用时。(7) 本品务必在单胺氧化酶抑制药（如呋喃唑酮、丙卡巴肼等）停用 14 日以上方可给药，而且应先试用小剂量（1/4 常用量），否则会发生难以预料的、严重的并发症，临床表现为多汗、肌肉僵直、血压先升高后剧降、呼吸抑制、发绀、昏迷、高热、惊厥，终致循环虚脱而死亡。(8) 注意勿将药液注射到外周神经干附近，否则产生局麻或神经阻滞。(9) 不宜用于 PCA，特别不能做皮下 PCA。(10) 本品过量中毒时可静脉注射纳洛酮 0.005 ~ 0.01 mg/kg，成人 0.4 mg，亦可用烯丙吗啡作为拮抗药。但本品中毒出现的兴奋惊厥等症状，拮抗药可使其症状加重，此时只能用地西泮或巴比妥类药物解除。当血内本品及其代谢产物浓度过高时，血液透析能促进排泄毒物。

【禁忌证】室上性心动过速、颅脑损伤、颅内占位性病变、慢性阻塞性肺病、支气管哮喘、严重肺功能不全等。严禁与单胺氧化酶抑制药同用。

【不良反应】本品的耐受性和成瘾性程度介于吗啡与可待因之间，一般不应连续使用。治疗剂量时可出现轻度的眩晕、出汗、口干、恶心、呕吐、心动过速及直立性低血压等。

【用法与用量】(1) 注射剂：①镇痛：成人肌内注射，一次 25 ~ 100 mg，一日 100 ~ 400 mg；极量，一次 150 mg，一日 600 mg。成人静脉注射一次按体重以 0.3 mg/kg 为限。②分娩镇痛：阵痛开始时肌内注射，一次：25 ~ 50 mg，每 4 ~ 6 小时按需重复；极量，一次量以 50 ~ 100 mg 为限。③麻醉前用药：麻醉前 30 ~ 60 分钟肌内注射，按体重 1.0 ~ 2.0 mg/kg。麻醉维持中，按体重 1.2 mg/kg 计算 60 ~ 90 分钟总用量，配成稀释液，成人一般每分钟静滴 1 mg，小儿滴速相应减慢。④手术后镇痛：硬膜外间隙注药，24 小时总用量按体重 2.1 ~ 2.5 mg/kg 为限。⑤晚期癌症患者解除中重度疼痛：应个体化给药，剂量可较常规为大，应逐渐增加剂量，直至疼痛满意缓解，但不提倡使用。⑥小儿基础麻醉：在硫喷妥钠按体重 3 ~ 5 mg/kg 10 ~ 15 分钟后，追加哌替啶 1 mg/kg 加异丙嗪 0.5 mg/kg 稀释至 10 ml 缓慢静脉注射。(2) 口服：成人，一次 50 ~ 100 mg，一日 200 ~ 400 mg；极量，一次 150 mg，一日 600 mg。小儿用量：一次按体重 1.0 ~ 1.5 mg/kg。

【制剂与规格】盐酸哌替啶片：① 25 mg；② 50 mg。

盐酸哌替啶注射液：① 1 ml：50 mg；② 2 ml：100 mg。

布桂嗪[保(乙)]

Bucinnazine

【适应证】本品为中等强度的镇痛药。适用于偏头痛，三叉神经痛，牙痛，炎症性疼痛，神经痛，月经痛，关节痛，外伤性疼痛，手术后疼痛，以及癌症痛（属二阶梯镇痛药）等。

【注意事项】本品为国家特殊管理的麻醉药品，必须严格遵守国家对麻醉药品的管理条例，管理本类药品，防止滥用。

【禁忌证】对本品过敏者。

【不良反应】少数患者可见有恶心、眩晕或困倦、黄视、全身发麻感等，停药后可消失。本品引起依赖性的倾向与吗啡类药相比为低，据临床报道，连续使用本品，可产生耐受性和成瘾，故不可滥用。

【用法与用量】(1) 口服：①成人，一次 30 ~ 60 mg，一日 3 ~ 4 次。②儿童，一次 1 mg/kg，疼痛剧烈时用量可酌增。(2) 皮下或肌内注射：成人，一次 50 ~ 100 mg，一日 1 ~ 2 次。疼痛剧烈时用量可酌增。对于慢性中重度癌痛患者，剂量可逐渐增加。首次及总量可以不受常规剂量的限制。

【制剂与规格】盐酸布桂嗪片：① 30 mg；② 60 mg。

盐酸布桂嗪注射液：① 1 ml：50 mg；② 2 ml：100 mg。

羟考酮[保(乙)]

Oxycodone

【适应证】缓解持续的中度到重度疼痛。

【注意事项】(1) 下列情况慎用：颅内高压、低血压、低血容量、胆道疾病、胰腺炎、肠道炎性疾病、前列腺肥大、肾上腺皮质功能不全、急性酒精中毒、慢性肝肾疾病和疲劳过度的年长或体弱的患者、黏液水肿、震颤性谵妄、可能出现麻痹性肠梗阻者。(2) 儿童尚无资料，不推荐 18 岁以下儿童使用。(3) 甲状腺功能低下者应适当减低用药剂量。(4) 长期使用会产生对药物的耐受性和生理依赖性，治疗突然停止时会发生戒断综合征。(5) 服药期间不得从事开车或操作机器等工作。(6) 本品为国家特殊管理的麻醉药品，必须严格遵守国家对麻醉药品的管理条例，使用与管理。

【禁忌证】呼吸抑制、颅脑损伤、麻痹性肠梗阻、急腹症、胃排空延迟、慢性阻塞性呼吸道疾病、肺源性心脏病、慢性支气管哮喘、高碳酸血症、已知对羟考酮过敏、中重度肝功能障碍、重度肾功能障碍（肌酐清除率 < 每分钟 10 ml）、慢性便秘、停用单胺氧化酶抑制药 < 2 周、妊娠期妇女或哺乳期妇女、手术前或手术后 24 小时内。

【不良反应】(1) 常见：便秘、恶心、呕吐、嗜睡、头晕、瘙痒、头痛、多汗和乏力。(2) 偶见：厌食、紧张、失眠、发热、精神错乱、腹泻、腹痛、血管舒张、感觉异常、皮疹、焦虑、欣快、抑郁、呼吸困难、体位低血压、寒战、噩梦、思维异常、呃逆、排尿困难、胆道痉挛、输尿管痉挛。(3) 罕见：眩晕、抽搐、定向障碍、面部潮红、情绪改变、幻觉、支气管痉挛、嗳气、气胀、肠梗阻、味觉异常、激动、遗忘、张力过高或过低、感觉过敏、肌肉不自主收缩、言语障碍、震颤、视觉异常、戒断综合征、闭经、性欲减退、阳痿、低血压、室上性心动过速、晕厥、外周性水肿、口渴、皮肤干燥、荨麻疹、变态反应、过敏反应或类过敏性反应、瞳孔缩小和绞痛。

【用法与用量】控释片必须整片吞服，不得掰开、咀嚼或研磨。初始用药剂量 5 mg，每 12 小时服用一次，继后，根据病情仔细滴定剂量或先用速效吗啡滴定剂量后转换为等效本品，个体差异较大。大多数患者的最高用药剂量为每 12 小时 200 mg。少数患者可能需要更高的剂量。口服本品 10 mg 相当于口服吗啡 20 mg。

【制剂与规格】控释片：① 5mg；② 10mg；③ 20 mg；④ 40 mg。

对乙酰氨基酚[基(基)]/羟考酮复方片（氨酚羟考酮片）[保(乙)] 本品每片含羟考酮 5 mg，对乙酰氨基酚 325 mg（或 500 mg）。用于中、重度急、慢性疼痛。口服：成人术后疼痛，一次 1 ~ 2 片，间

隔4～6小时可重复用药1次。癌症、慢性疼痛，一次1～2片，一日3次。勿空腹服用。

芬太尼[基(基)，保(甲)]

Fentanyl

见17.2.5.1。

芬太尼透皮贴剂[保(乙)]

Fentanyl Transdermal Patch

【适应证】中度到重度慢性疼痛以及那些只能依靠阿片类镇痛药治疗的难以消除的疼痛。

【注意事项】(1) 肝、肾功能不全者减量使用。(2) 除非确实需要，否则不应在妊娠期使用本品；不建议在分娩过程中使用。(3) 哺乳期妇女不宜用本品。(4) 以下情况慎用：阿片类药物不耐受者、慢性肺部疾病、呼吸抑制、颅内压升高、心脏疾病、肝肾疾病、老年患者、甲状腺功能减退、肾上腺皮质功能减退、原因不详的腹痛综合征、发热患者或应用外部发热源者、前列腺癌、急性酒精中毒者。(5) 用本品时应避免进行精细操作。(6) 出现严重不良反应的患者应在停止使用本品后继续观察24小时。(7) 不能将本品分拆、切割或以任何其他方式损坏。(8) 复诊时须将用过的贴剂对折放入原包装袋，交回医疗机构。

【禁忌证】已知对芬太尼或对本贴剂中黏附剂敏感者、急性或手术后疼痛的治疗、40岁以下非癌性慢性疼痛患者（艾滋病、截瘫患者疼痛治疗不受年龄及疼痛病史的限制）。

【不良反应】常见恶心，呕吐，便秘，低血压，嗜睡，头晕，失眠。较常见焦虑，忧郁，食欲减退，不自主肌收缩，心悸，感觉减退，呵欠，鼻炎，腹痛，消化不良，口干，瘙痒，体温变化，多汗，疲乏，不适，流感样症状，外周水肿，瘙痒，尿潴留，戒断综合征。罕见过敏性休克，过敏反应，意识模糊，惊厥，震颤，记忆减退，性功能障碍，呼吸抑制。与所有的强效阿片类制剂相同，最严重的不良反应为肺通气不足。反复使用可能出现耐药，身体依赖和心理依赖。

【用法与用量】本品的剂量应根据患者的个体情况而决定，并应在给药后定期进行剂量评估。本品应贴于躯干或上臂未受刺激及未受辐射的平整皮肤表面（最好选择无毛发部位）。用药前可用清水清洗贴用部位，在皮肤完全干燥后再用药。本品应在开封后立即使用。使用时用手掌用力按压30秒钟，以确保贴剂与皮肤完全接触。本品可以持续贴用72小时，在更换贴剂时，应更换粘贴部位。(1) 初始剂量应依据使用短效阿片药物剂量转换决定。未使用过阿片类药物的患者应以芬太尼透皮贴剂的最低剂量25μg为起始剂量，并根据疼痛缓解程度进行剂量调整，调整幅度为每小时25μg，以达到最低的适合剂量。使用过阿片类药物的患者：应按下述方法将口服或肠外给药转换本品。①计算前24小时镇痛药用量。②应用表17-9将上述用量转换为等效的口服吗啡剂量。表17-9中所有肌内注射和口服剂量相当于肌内注射吗啡10 mg的等效镇痛剂量。③表17-10列出了根据24小时口服吗啡的剂量范围推算出的本品的剂量。④如有需要，可进行调整，调整幅度为每小时25μg。(2) 剂量的调整及维持：每72小时应更换一次本品贴剂。应依据个体情况调整剂量，直至达到满意的镇痛效果。如果首次用药镇痛效果不满意，可根据疼痛强度在3日后增加剂量。其后每3日进行一次剂量调整。剂量增加的幅度通常为每小时25μg，但同时应考虑附加的疼痛治疗及患者的状态。当剂量大于每小时75μg时，可以使用1片以上本品贴剂。患者可能定时需要短效镇痛药，以缓解突发性疼痛。在本品剂量超过每小时300μg时，一些患者可能需要额外的或改变阿片类药物的用法。(3) 终止治疗：去除本品贴剂后，应逐渐开始其他阿片类药物的替代治疗，并从低剂量开始缓慢加量。这是因为去除本品贴剂后，血中芬太尼浓度逐渐降低。血中芬太尼浓度下降50%，大约需要17小时甚至更长，故应逐渐停药。

【制剂与规格】芬太尼透皮贴剂：①25μg/小时，4.2 mg/贴；②50μg/小时，8.4 mg/贴；③5μg/小时，12.6 mg/贴。

表 17-9 镇痛作用等效转换参考

药物名称	等效镇痛剂量（mg）	
	肌内注射 *	口 服
吗啡	10	30（若为重复给药）** 60（若为单次或间歇给药）
氢吗啡酮	1.5	7.5
美沙酮	10	20
羟考酮	15	30
左啡诺	2	4
羟吗啡酮	1	10（直肠给药）
度冷丁	75	–
可待因	130	200
丁丙诺啡	0.4	0.8（舌下含服）

* 依据一项将上述药物的肌内注射剂量与吗啡相比确定相对强度的单次剂量研究。口服推荐剂量来自于非胃肠道途径向口服途径的转换；** 根据对慢性疼痛患者治疗的临床经验，吗啡的口服／肌内注射作用强度比为 1 ∶ 3

表 17-10 根据吗啡一日口服剂量推算出的本品推荐剂量

24 小时口服吗啡剂量（mg/24 小时）	本药剂量（μg/小时）
<135	25
135 ~ 224	50
225 ~ 314	75
315 ~ 404	100
405 ~ 494	125
495 ~ 584	150
585 ~ 674	175
675 ~ 764	200
765 ~ 854	225
855 ~ 944	250
945 ~ 1034	275
1035 ~ 1124	300

* 在临床试验中以口服吗啡日剂量范围为基础转换为本品

丁丙诺啡

Buprenorphine

【适应证】各种术后疼痛、癌性疼痛、外伤或烧伤后疼痛、肢体痛和心绞痛。

【注意事项】(1) 肝功能不全时，药物作用可延长，注意调整给药间隔时间。(2) 孕妇、哺乳期妇女不宜应用。(3) 以下情况慎用：颅脑外伤、呼吸抑制、老弱者。(4) 7 岁以下儿童不宜使用。(5) 本品口服易被胃肠道吸收，但首关消除效应大，故宜舌下含服或注射给药。(6) 本品属于第一类精神药品，应按有关规定使用和管理。(7) 与地西泮联用，可发生心脏性或呼吸性虚脱。(8) 已用其他吗啡类药物者应用本品，可能发生戒断症状，故一般不可与其他吗啡类药物联合应用。

【禁忌证】对本品过敏者、轻微疼痛和疼痛原因不明者禁用本品。

【不良反应】常见有头晕、嗜睡、恶心、呕吐、出汗、低血压、缩瞳、肺通气不足，以及其他中枢、心血管、呼吸、皮肤和眼部不良反应。

【用法与用量】用于镇痛，肌内注射或缓慢静脉注射：一次 0.3 ~ 0.6 mg，一日 3 ~ 4 次。单剂量作用可持续 6 ~ 8 小时。舌下含服：一次 0.4 ~ 0.8 mg，每隔 6 ~ 8 小时 1 次。

【制剂与规格】盐酸丁丙诺啡舌下含片：① 0.2 mg；② 0.4 mg。

盐酸丁丙诺啡注射液：① 1 ml : 0.15 mg；② 1 ml : 0.3 mg。

曲马多 [保（乙）]

Tramadol

【适应证】用于中度至重度疼痛。

【注意事项】(1) 哺乳期妇女使用时约有 0.1% 剂量可经乳汁分泌，故单次应用不必中断哺乳。(2) 肝肾功能不全者慎用。(3) 以下情况慎用对阿片类药物敏感者、有心脏疾病患者及老年人。(4) 对阿片类药依赖、有头部损伤、休克、不明原因的神志模糊、呼吸中枢及呼吸功能异常、

颅内压升高的患者，应用本品应特别小心。(5) 当使用超过推荐的日使用剂量的上限(400 mg) 时有出现惊厥的危险，合并应用能降低痉挛阈值或其本身可诱发惊厥的药物（如抗抑郁药，神经阻滞药等）时惊厥出现的危险性增加。(6) 禁止作为对阿片类有依赖性患者的代替品。(7) 有药物滥用或依赖性倾向的患者不宜使用。本品属于第二类精神药品，应按有关规定使用和管理。(8) 本品有可影响患者的驾驶和机械操作能力，尤其是与乙醇同时服用时更为严重。(9) 突然撤药可能导致戒断症状，建议缓慢减药。(10) 过量时呼吸抑制可用纳洛酮解救，曲马多过量不能单纯应用血液透析和血液滤过治疗。

【禁忌证】对曲马多及其赋形剂过敏者；妊娠期妇女；1 岁以下儿童；乙醇、镇静剂、镇痛剂、阿片类或者精神类药物急性中毒患者；正在接受单胺氧化酶抑制药治疗或在过去 14 日服用过此类药物者；本品不得用于戒毒治疗。

【不良反应】常见恶心、呕吐、便秘、口干、头晕、嗜睡、出汗。少见过敏反应、低血压、心动过速、胃肠功能紊乱、头痛、视觉异常、情绪不稳、欣快、活动减退、功能亢进、认知和感觉障碍、惊厥、精神错乱、药物依赖性、幻觉、戒断综合征、瘙痒、皮疹、荨麻疹、血管神经性水肿、排尿障碍、尿潴留、呼吸困难、支气管痉挛、呼吸抑制，罕见高血压和心动过缓。

【用法与用量】(1) 注射剂：成人及 12 岁以上儿童，肌内注射，一次 100 mg，必要时可重复。一般情况下一日总量为 400 mg，但在治疗癌痛和重度术后疼痛时可应用更高日剂量。(2) 缓释片：整片吞服，一般从一次 50 mg 开始，12 小时服用一次，根据患者疼痛程度可调整用药剂量。一般成人及 14 岁以上中度疼痛的患者，单剂量为 50 ~ 100 mg；体重不低于 25 千克的 1 岁以上儿童的服用剂量为每千克体重 1 ~ 2 mg。本品最低剂量为 50 mg（半片），最高日剂量通常不超过 400 mg，治疗癌性痛时也可考虑使用较大剂量。肝、肾功能不全者，应酌情使用。老年患者用量，应有所减少。两次服药的时间间隔，不得少于 8 小时。

【制剂与规格】曲马多缓释片：100 mg。

曲马多注射液：2 ml : 100 mg。

注射用曲马多：① 50 mg；② 100 mg。

氨酚曲马多 [保（乙）]

Paracetamoland Tramadol Hydrochloride Tablets

【适应证】本品用于中度至重度急性疼痛的短期治疗。

【注意事项】(1) 服用推荐剂量的曲马多，有癫痫发作的报道。(2) 有可待因和其他阿片类物质过敏史的患者发生过敏反应的危险增加，不宜使用本品。(3) 有呼吸抑制危险的患者慎用本品。当大剂量曲马多与麻醉药或酒精同时服用时，可能导致呼吸抑制，可按药物过量处理此种情况。如使用纳洛酮，应慎重，因可引发癫痫。(4) 当患者使用中枢神经系统镇静药（如酒精、阿片类物质、麻醉药、吩噻嗪类、镇静催眠药物）时，慎用本品或降低剂量。(5) 颅内压升高或脑部创伤的患者慎用本品。(6) 本品不应用于对阿片依赖的患者。对其他阿片类物质有依赖史的患者，使用曲马多可能会再次引起机体依赖。(7) 长期严重酒精滥用者服用过量的对乙酰氨基酚可能增加肝脏毒性的危险。(8) 如果突然停止服用本品，可能会出现戒断症状。有罕见的惊恐发作、严重焦虑、幻觉、感觉异常、耳鸣和中枢神经系统症状的报告。临床经验证明逐渐减少药量可减轻戒断症状。(9) 服用单胺氧化酶抑制药的患者应特别慎用本品。同时服用曲马多和单胺氧化酶抑制药或选择性 5- 羟色胺再摄取抑制药可增加不良反应的危险，包括癫痫和 5- 羟色胺综合征。(10) 不推荐肝损害患者服用本品。(11) 服用本品不应超过推荐剂量。(12) 不应与含曲马多或对乙酰氨基酚的其他药物同时服用。(13) 本品可能影响从事如驾车或操作机器等具有潜在危险工作的能力。

【禁忌证】已知对曲马多、对乙酰氨基酚或本品中其他成分或阿片类物质过敏的患者禁用。酒精、催眠药、麻醉药、中枢镇痛药、阿片类或精神病药物急性中毒的患者禁用。

【不良反应】最常见的为中枢神经系统和胃肠道系统的不良反应。(1) 最常见的不良事件为恶心、头晕和嗜睡。此外，下面一些不良反应也是较常见的，但是发生率较低：①全身：乏力、疲劳、潮热。②中枢和周围神经系统：头痛、震颤等。③肠道系统：腹痛、便秘、腹泻、消化不良、胃肠胀气、口干、呕吐。④精神系统：厌食、焦虑、思维混乱、欣快、失眠、紧张。⑤皮肤及附属物：瘙痒、皮疹、多汗。(2) 不常见的且可能与本品有关的不良反应包括：①全身：胸痛、强直、晕厥、戒断综合征。②心血管系统：高血压、高血压加重、低血压。③中枢和周围神经系统：共济失调、惊厥、张力增加、偏头痛、偏头痛加重、不随意肌收缩、感觉异常、木僵、眩晕。④胃肠道系统：吞咽困难、黑粪、舌水肿。⑤听觉和前庭：耳鸣。⑥心率和心律：心律失常、心悸、心动过速。⑦肝脏和胆道系统：肝功能检查异常。⑧代谢和营养：体重下降。⑨精神系统：健忘、人格解体、抑郁、药物滥用、情绪不稳定、幻觉、阳萎、梦魇、思维异常。⑩血液系统：贫血。⑪呼吸系统：呼吸困难。⑫泌尿系统：蛋白尿、排尿异常、少尿、尿潴留。⑬视觉：视觉异常。

【用法与用量】口服：按照下述方法服用本品，或遵医嘱。(1) 成人和超过16岁的儿童，根据止痛的需要每4～6小时服用1～2片，一日最多不得超过6片。无须考虑食物的影响。(2) 尚无本品用于儿童(16岁以下)的安全性和有效性的资料。(3) 老年患者用药剂量的选择应慎重，并充分考虑可能发生的潜在风险。(4) 目前尚无肾功能损害患者的研究资料，应慎用。如必须使用时，肌酐清除率低于每分钟30 ml的患者，建议延长服药间隔，且12小时的用量不得超过2片。

【制剂与规格】氨酚曲马多片：每片含盐酸曲马多37.5 mg，对乙酰氨基酚325 mg。

四氢帕马丁[保(乙)]

Tetrahydropalmatine

【适应证】用于胃肠、肝胆系统疾病引起的疼痛以及产后宫缩痛，月经痛，人工流产疼痛等。

【注意事项】孕妇慎用。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】偶见眩晕、恶心。大剂量对呼吸中枢有一定抑制作用，有时还可引起锥体外系症状。

【用量与用法】(1) 镇痛：口服，一次100～150 mg，一日2～4次；皮下注射，一次60～100 mg。(2) 痛经：口服，一次50 mg。(3) 催眠与镇静：口服，一次100～200 mg。

【制剂与规格】四氢帕马丁片：50 mg。

四氢帕马丁注射液：① 2 ml : 60 mg；② 2 ml : 100 mg。

眼镜蛇毒

Cobratoxin

【适应证】用于治疗各种慢性疼痛，血管性头痛、三叉神经痛、坐骨神经痛、关节痛和晚期癌痛。

【注意事项】(1) 治疗剂量较安全，剂量过大可引起膈肌麻痹而使呼吸抑制。(2) 严重肾病、严重高血压、冠心病患者慎用。(3) 个别患者初始应用本品后疼痛加重，但继续应用效果明显。(4) 本品镇痛作用出现较慢，用药3～5日才充分发挥疗效。

【不良反应】少见头晕、口干、一过性血压下降，一般无须特殊处理。

【禁忌证】对过敏体质、妊娠期妇女、青光眼、高热者禁用。

【用法与用量】肌内注射：第1次肌内注射0.5 ml，0.5小时后如无不良反应再注射1.5 ml，一日2 ml，连续10日为1个疗程；间隔3日后可进行第2个疗程。第2疗程后，必要时可给予维持量，一次2 ml，一周2次，一般应用1～2个疗程，最大剂量为一日6 ml。

【制剂与规格】眼镜蛇毒注射液：2 ml : 70 μg。

第18章 免疫制剂与疫苗

18.1 免　疫

疫苗和免疫制剂是生物制品的一个类别，是应用普通的或以基因工程、细胞工程、蛋白质工程、发酵工程等生物技术获得的微生物、细胞及各种动物和人源的组织和液体等生物材料制备，用于人类疾病预防和治疗的生物制剂。

免疫学是应用疫苗和免疫制剂的理论基础。免疫是人体容纳自身物质，消灭外来物质的能力。由于大多数微生物被免疫系统鉴别为外来物质（异物），因而这种识别能力为人体提供了针对传染病的保护作用。对微生物的免疫通常由其相对应的抗体显示出来。免疫一般具有高度特异性，只针对某一种或一组密切相关的生物体。获得免疫有两种基本机制——主动免疫和被动免疫。

18.1.1 主动免疫

主动免疫是免疫系统受抗原刺激产生的特异性体液免疫（抗体）和细胞免疫，是由机体自身免疫系统产生的保护力。

18.1.1.1 减毒活疫苗

减毒活疫苗来源于“野生”的细菌和病毒，这些细菌或病毒的致病力通常在实验室通过传代培养而被削弱。目前应用的减毒活疫苗包括卡介苗、口服脊髓灰质炎疫苗、麻疹疫苗、风疹疫苗、腮腺炎疫苗、乙脑活疫苗、水痘疫苗等。减毒活疫苗通常能够刺激机体产生持久的免疫力，但是没有自然感染产生的免疫持续时间长。

18.1.1.2 灭活疫苗

(1) 全细菌和全病毒灭活疫苗：全细菌和全病毒灭活疫苗是细菌、病毒或立克次体等病原体的培养物，经化学或物理方法灭活后制成，已丧失致病力，但仍保留其免疫原性，如乙脑灭活疫苗、甲肝灭活疫苗、百日咳菌苗、流感全病毒灭活疫苗等。

(2) 组分疫苗：组分疫苗包括蛋白质疫苗和多糖疫苗。蛋白质疫苗包括类毒素和亚单位疫苗。类毒素是细菌在液体培养条件下，产生外毒素，经脱毒提纯等工艺

制成，这类可溶性抗原通常需要加入佐剂（如氢氧化铝）才能产生良好的免疫原性，如破伤风类毒素、白喉类毒素等。多糖疫苗包括纯化疫苗和结合疫苗。纯化疫苗由来自细菌的纯化了的细胞壁多聚糖组成，如流脑多糖疫苗、肺炎球菌多糖疫苗；结合疫苗是将多聚糖用化学方法与蛋白质连接而得到的疫苗，这种连接使多糖成为更有效的疫苗，如b型流感嗜血杆菌结合疫苗。

18.1.1.3 重组疫苗

疫苗抗原也可以通过基因工程生产。这些制品有时被称作重组疫苗。乙肝疫苗是通过将乙肝病毒的基因片断插入到酵母细胞的基因里而生产出来的。改良的酵母细胞在它生长时表达出纯的乙肝表面抗原。活伤寒疫苗（Ty21a）是通过基因改良使沙门伤寒杆菌不再致病。通过基因工程生产的减毒流感活疫苗在鼻咽部黏膜有效繁殖，在肺组织中不繁殖。

18.1.2 被动免疫

被动免疫是将抗体从人或者动物输入到其他人或动物获得。被动免疫可在短时间内为免疫对象提供足够数量的抗体以得到针对一些感染的保护，但是这种保护持续时间很短，常在数周或者数月内逐渐消失。因此被动免疫通常需要多次重复接种。

18.2 预防接种

预防接种是预防和控制传染病的综合措施之一，是指利用免疫制剂和疫苗通过适宜的途径对机体进行接种，使机体获得对某种疾病的特异免疫力，以提高个体或群体的免疫水平，从而达到保护机体，预防和控制针对疾病的目的。

18.2.1 免疫程序

免疫程序指针对某一特定人群（如儿童）预防相应疾病需要接种疫苗种类、接种次序及有关要求所作的具体规定。免疫程序的内容包括免疫起始月（年）龄、接种针次、针次之间的时间间隔，加强免疫及几种疫苗联合免疫的问题。免疫程序包括儿童免疫程序、成人免疫程序、特殊健康人群的免疫程序等。

18.2.1.1 儿童免疫程序

儿童免疫程序，见表18-1。

程序说明如下。

（1）国家免疫规划儿童常规免疫的疫苗完成基础免疫的时间要求：①乙肝疫苗、卡介苗、脊髓灰质炎疫苗、百白破疫苗、麻疹风疹疫苗、乙脑减毒活疫苗＜12月龄完成。②A群流脑疫苗≤18月龄完成。③甲肝疫苗≤24月龄完成。

（2）免疫程序所列各种疫苗第1剂的接种时间为最小免疫起始时间。

（3）脊髓灰质炎疫苗、百白破疫苗基础免疫各剂次的间隔时间应≥28日。

（4）乙肝疫苗接种3剂次，儿童出生时、1月龄、6月龄各接种1剂次，第1剂在出生后24小时内尽早接种。对已知母亲乙肝病毒表面抗原阳性的新生儿，在自愿的基础上，提倡新生儿在接种首剂乙肝疫苗的同时，在不同部位自费接种100U乙肝免疫球蛋白。

（5）百白破疫苗接种4剂次，儿童3月龄、4月龄、5月龄和18～24月龄各接种1剂次。无细胞百白破疫苗免疫程序与百白破疫苗程序相同。无细胞百白破疫苗供应不足阶段，按照第4剂次至第1剂次的顺序，用无细胞百白破疫苗替代百白破疫苗；不足部分继续使用百白破疫苗。

（6）麻风腮疫苗（麻疹、风疹、流行性腮腺炎疫苗）。麻风腮疫苗供应不足阶段，使用含麻疹成分疫苗的过渡期免疫程序。8月龄接种1剂次麻疹风疹疫苗，麻疹风疹疫苗不足部分继续使用麻疹疫苗。18～24月龄接种1剂次麻风腮疫苗，麻风腮疫苗不足部分使用麻腮疫苗替代，麻腮疫苗不足部分继续使用麻疹疫苗。当发生局部麻疹流行而且8月龄以下儿童发病率较高时，麻疹疫苗应急接种对象儿童可以提前到6月龄，但该剂次麻疹免疫不计人其常规免疫，在该儿童8月龄以后，再按照规定的免疫程序注射1剂次麻疹疫苗。

表 18-1 儿童免疫规划程序

疫 苗	接种对象月（年）龄	接种剂次	接种剂量／剂次	备 注
乙肝疫苗	0、1、6 月龄	3	酵母苗 5μg/0.5ml, CHO苗: 10μg/1ml、20μg/1ml	出生后 24 小时内接种第 1 剂次，第 1、2 剂次间隔≥ 28 日
卡介苗	出生时	1	0.1 ml	
脊髓灰质炎疫苗	2、3、4 月龄，4 周岁	4	1 粒	第 1、2 剂次，第 2、3 剂次间隔均≥28 日
百白破疫苗	3、4、5 月龄，18 ~ 24 月龄	4	0.5 ml	第 1、2 剂次，第 2、3 剂次间隔均≥28 日
白破疫苗	6 周岁	1	0.5 ml	
麻疹风疹疫苗（麻疹疫苗）	8 月龄	1	0.5 ml	
麻腮风疫苗（麻腮疫苗、麻疹疫苗）	18 ~ 24 月龄	1	0.5 ml	
乙脑减毒活疫苗	8 月龄、2 周岁	2	0.5 ml	
A 群流脑疫苗	6 ~ 18 月龄	2	30 μg/0.5 ml	第 1、2 剂次间隔 3 个月
A+C 流脑疫苗	3 周岁、6 周岁	2	100 μg/0.5 ml	两剂次间隔≥ 3 年；第 1 剂次与 A 群流脑疫苗第 2 剂次间隔≥ 12 个月
甲肝减毒活疫苗	18 月龄	1	0.5 ml	
乙脑灭活疫苗	8 月龄（2 剂次），2 周岁、6 周岁	4	0.5 ml	第 1、2 剂次间隔 7 ~ 10 日
甲肝灭活疫苗	18 月龄、24 ~ 30 月龄	2	0.5 ml	两剂次间隔≥ 6 个月

① CHO 疫苗用于新生儿母婴阻断的剂量为 20 μg/ml；②未收入药典的疫苗，其接种部位、途径和剂量参见疫苗使用说明书

（7）如需同时接种≥ 2 种国家免疫规划疫苗，一次最多只能接种两种注射疫苗和一种口服疫苗，注射疫苗应在不同部位接种。严禁将几种疫苗混合吸入同一支注射器内接种。两种减毒活疫苗如未同时接种，应间隔≥ 28 日。

（8）未完成基础免疫的≤ 14 岁儿童应尽早补种。在补种时掌握以下原则：①未接种国家免疫规划疫苗常规免疫的儿童，按照免疫程序进行补种。②未完成国家免疫规划疫苗常规免疫程序规定剂次的儿童，只需补种未完成的剂次。③未完成百白破疫苗免疫程序的 3 月龄至 5 岁儿童使用百白破疫苗；6 ~ 11 岁儿童使用白破疫苗；≥ 12 岁儿童使用成人及青少年用白破疫苗。④未完成脊髓灰质炎疫苗免疫程序的儿童，< 4 岁儿童未达到 3 剂次（含强化免疫等），应补种完成 3 剂次。≥ 4 岁儿童未达到 4 剂次（含强化免疫等），应补种完成 4 剂次。⑤未完成两剂次含麻疹成分疫苗接种（含强化免疫等）的儿童，应补种完成两剂次。⑥未接种卡介苗的< 3 月龄儿童可直接补种，3 月龄至 3 岁儿童对 PPD 试验阴性者补种，≥ 4 岁儿童不予补种。

18.2.1.2 成人免疫程序

目前成人可以接种的疫苗有破伤风-白喉疫苗、破伤风类毒素、甲肝疫苗、乙肝疫苗、麻疹疫苗、风疹疫苗、腮腺炎疫苗、流感疫苗、肺炎球菌多糖疫苗、狂犬病疫苗等10多种。

育龄期妇女慎用麻疹疫苗、腮腺炎疫苗和风疹疫苗；生育期妇女应该检测风疹抗体，血液筛查阴性的个体应该接种风疹疫苗。妊娠或者打算在4周内妊娠的妇女不应该接受风疹疫苗接种。

18.2.2 预防接种的接种时间和间隔

接种疫苗的时间和间隔是正确使用疫苗的两个最重要的问题。

18.2.2.1 抗体-疫苗之间的药物相互作用

灭活抗原受循环抗体的影响不明显，因此，它们可在输入抗体之前、之后或同时接种。抗体（免疫球蛋白）和疫苗同时接种可用于某些传染病的暴露后预防，如乙肝、狂犬病和破伤风。

先接种活疫苗，在使用抗体之前必须至少等待2周（即1个潜伏期）。麻疹疫苗病毒对循环抗体最敏感，脊髓灰质炎和轮状病毒疫苗受影响最小。

如果在接种MMR或水痘疫苗之前使用了抗体，为了降低和减少抗体可能产生的影响，必须等到抗体消退后再注射疫苗。

18.2.2.2 不同疫苗的不同时接种

两种减毒活疫苗，至少应间隔4周接种，这是为了减少和消除先注射的疫苗对后注射疫苗的干扰。口服活疫苗可以在接种其中一种之前或之后的任何时间接种另一种疫苗。所有其他由两种灭活疫苗组成的联合疫苗或者活疫苗（注射或口服）与灭活疫苗都可相互在接种前后任何的时间接种。

18.2.2.3 同一种疫苗不同剂次的时间间隔

增加多剂次疫苗不同剂次的间隔不降低疫苗的效果；减少多剂次疫苗不同剂次的间隔可干扰抗体反应和降低保护作用。

18.2.2.4 疫苗的剂次效应关系

减毒活疫苗单剂次一般产生长期持久的免疫；灭活疫苗需要多次接种（或多剂次），并需要定期加强保持免疫。

18.2.3 预防接种的不良反应

预防接种的目的是针对某些特异性抗原产生免疫反应。疫苗不良反应包括发生在预防接种后的任何不利反应。不良反应可能是真正的疫苗反应，也可能是偶然事件。疫苗的不良反应可分为三大类：局部反应、全身反应和过敏反应。局部反应最常见而不严重。过敏反应最严重，发生率最低。

疫苗不良反应的报告：各级各类医疗机构、疾病预防控制机构和接种单位及其执行职务的人员在发现预防接种异常反应、疑似预防接种异常反应或者接到相关报告，应当及时向所在地的县级卫生行政部门、药品监督管理部门报告，并填写疑似预防接种异常反应报告卡。

18.2.3.1 预防接种的禁忌证

禁忌证是指个体在某种状态下接种疫苗后会极大地增加发生严重不良反应的机会。它是以个体的状态决定的，而不是疫苗本身，如果在有禁忌证的情况下接种，产生的不良反应将严重伤害被接种者。当有禁忌证存在时，不应接种疫苗。大多疫苗都有使用禁忌证，产品使用说明书和疫苗针对性疾病应该给予详细说明。

（1）过敏：接种某种疫苗后曾发生严重过敏反应，是以后接种该疫苗的禁忌证；曾经有鸡蛋或鸡蛋蛋白过敏史的人不应该接种以鸡蛋为培养基的疫苗；一些疫苗含有微量的抗菌成分，对抗菌剂极度敏感的个体不能接种此类疫苗。

（2）免疫抑制：严重免疫抑制的人不应接种活疫苗。单纯B细胞缺陷的人可接种水痘疫苗。疾病和药物两者都可引起明显的免疫抑制，先天免疫缺陷、白血病、淋巴病、非特异性恶病质等不应接种活疫苗。家庭有免疫抑制者的人不能给予口服脊髓灰质炎疫苗。某些药物可以引起免疫抑制，如接受烷基化药物或抗代谢药物治疗或放射治疗的癌症患者不应接种活

疫苗，在化学药物治疗停止至少 3 个月后才可接种活疫苗。接受大剂量皮质激素治疗的人不能接种活疫苗，这包括每日按体重 > 2 mg/kg 泼尼松或每日接受总量 20 mg 以上泼尼松治疗超过 14 日者。

18.2.3.2 预防接种的慎用证

慎用证的意思和禁忌证相近，是指个体在某种状态下接种疫苗后会增加发生严重不良反应的机会，或者疫苗可能失去免疫效力（如给通过输血获得麻疹被动免疫的人接种麻疹疫苗）。慎用证虽然可能产生机体损害，但发生率比禁忌证小。一般情况下，如果存在慎用证，则应建议推迟接种。然而，当接种疫苗的利益超过不良反应风险时，接种者可以决定接种疫苗。

（1）妊娠：对妊娠期妇女进行预防接种所关注的是胎儿感染（而且是理论上的）。原则上不应给妊娠期妇女接种活疫苗。但是如果暴露于烈性传染病（如黄热病），则接种疫苗的必要性通常要高过对胎儿的危险性。接触妊娠期妇女的家庭易感成员应该接种 MMR，水痘疫苗，也可以接种流感疫苗。

（2）HIV 阳性母亲所生儿童的国家免疫规划疫苗接种建议：原则上 HIV 阳性母亲所生儿童在接种前不必进行 HIV 筛查。对于 HIV 阳性母亲所生儿童 HIV 感染状况分 3 种，HIV 感染不详儿童、HIV 阳性儿童、HIV 阴性儿童。对 HIV 阳性母亲所生儿童国家免疫规划疫苗接种具体要求，如表 18-2。

① HIV 感染不详儿童：出生后暂缓接种卡介苗、口服脊髓灰质炎疫苗；当确认儿童 HIV 阴性后再予以补种；当确认 HIV 阳性，不予接种卡介苗、口服脊髓灰质炎疫苗。已知母亲 HIV 阳性的新生儿，如经医疗机构诊断，出现了 HIV 相关症状或免疫抑制症状，不予接种麻腮风疫苗、麻疹风疹疫苗、麻腮疫苗、乙脑减毒活疫苗、甲肝减毒活疫苗；如无 HIV 相关症状，可接种麻腮风疫苗、麻疹风疹疫苗、麻腮疫苗。乙肝疫苗、A 群流脑疫苗和 A+C 群流脑疫苗可按照免疫程序接种。接种免疫规划疫苗时，应使用乙脑灭活疫苗、甲肝灭活疫苗和无细胞百白破疫苗。其他疫苗的接种可参考疫苗说明书的规定。

② HIV 阳性儿童：不予接种卡介苗、

表 18-2 HIV 阳性母亲所生儿童的国家免疫规划疫苗接种建议

疫苗	HIV 阳性儿童		HIV 感染不详儿童		HIV 阴性儿童
	有症状或有免疫抑制	无症状和无免疫抑制	有症状或有免疫抑制	无症状	
乙肝疫苗	✓	✓	✓	✓	✓
卡介苗	×	×	暂缓接种	暂缓接种	✓
脊髓灰质炎疫苗	×	×	暂缓接种	暂缓接种	✓
无细胞百白破疫苗	✓	✓	✓	✓	✓
白破疫苗	✓	✓	✓	✓	✓
麻疹风疹疫苗	×	✓	×	✓	✓
麻风腮疫苗	×	✓	×	✓	✓
麻腮疫苗	×	✓	×	✓	✓
乙脑灭活疫苗	✓	✓	✓	✓	✓
乙脑减毒活疫苗	×	×	×	×	✓
A 群流脑疫苗	✓	✓	✓	✓	✓
A+C 群流脑疫苗	✓	✓	✓	✓	✓
甲肝减毒活疫苗	×	×	×	×	✓
甲肝灭活疫苗	✓	✓	✓	✓	✓

暂缓接种，当确认儿童 HIV 阴性后再补种，HIV 阳性儿童不予接种；“✓”表示“无特殊禁忌”；“×”表示“禁止接种”；由医疗机构出具儿童是否有 HIV 感染症状，或是否有免疫抑制的诊断

口服脊髓灰质炎疫苗。如经医疗机构诊断，出现了 HIV 相关症状或免疫抑制症状，不可接种麻腮风疫苗、麻疹风疹疫苗、麻腮疫苗、乙脑减毒活疫苗、甲肝减毒活疫苗；如无 HIV 相关症状和无免疫抑制症状，可接种麻腮风疫苗、麻疹风疹疫苗、麻腮疫苗。乙肝疫苗、A 群流脑疫苗和 A+C 群流脑疫苗可按照免疫程序接种。接种免疫规划疫苗时，应使用乙脑灭活疫苗、甲肝灭活疫苗和无细胞百白破疫苗。其他疫苗的接种可参考疫苗说明书的规定。

③ HIV 阴性儿童：按照免疫程序，完成免疫规划疫苗接种。

(3) 接受造血干细胞移植者：造血干细胞移植接受者在接受造血干细胞移植后应常规进行加强接种。而不管什么来源的干细胞移植，加强接种灭活疫苗应在干细胞移植后 12 个月开始。造血干细胞移植接受者的家人及其他密切接触者，护理造血干细胞移植接受者的工作人员应适当接种疫苗，特别是流感、麻疹和水痘等疫苗。

(4) 中度和重度急性疾病：中重度急性疾病，应当延迟至患者好转后接种灭活疫苗和活疫苗免疫。

(5) 近期使用血液制品：血液制品可以干扰注射活疫苗病毒的复制。最近接受过血液制品者对 MMR 和水痘疫苗是慎用证。Palivizumals (Synagis) 是用于治疗呼吸道合胞病毒 (RSV) 的单克隆抗体，它仅含有抗呼吸道合胞病毒 (RSV) 的抗体，因此不干扰活疫苗的预防接种。水痘和 MMR 疫苗应该在输入血液制品前 14 日进行接种，或者延迟至抗体已衰退后接种。如果 MMR 在输血后很短时间内接种，被接种者应做免疫测试或在适当的间隔时间后补种。血液制品的循环抗体不影响灭活疫苗，因此不是灭活疫苗禁忌证。

18.2.3.3 被误认为是预防接种禁忌证的情况

一些卫生保健工作人员误认为某些情况是预防接种的禁忌证和慎用证，结果错过了需要接种疫苗的时机。常被误认为是预防接种禁忌证的情况有轻微疾病、哺乳和妊娠、非先天性过敏以及患者家族史等。

(1) 轻微疾病：患有轻微急性疾病如低热、上呼吸道感染、受凉、中耳炎、轻度腹泻的儿童可以并应该进行预防接种。低热不是预防接种的禁忌证，如果儿童没有疾病的表现或者儿童家长没有谈到儿童最近生病，在预防接种前测量体温是不必要的。

(2) 抗菌药治疗：抗菌药对预防接种的免疫反应没有影响，使用抗菌药通常不影响活病毒疫苗。

(3) 疾病暴露或康复：如果一个儿童没有严重疾病，他（她）应该接种疫苗。没有疾病暴露或康复影响疫苗反应或增加不良反应概率的证据。

(4) 家庭有妊娠、免疫抑制者或哺乳者：接触妊娠期妇女和免疫抑制的健康家庭成员接种疫苗非常重要，因为这样能够降低妊娠期妇女和免疫抑制者的暴露机会。

(5) 早产儿和低体重儿：预防接种应该根据儿童实际年龄按程序进行，早产儿在婴幼儿时期对疫苗反应充分。

(6) 非疫苗相关过敏：非特异性过敏、鸭或鸭毛过敏、青霉素过敏，有过敏症的亲属，以及做过过敏皮试的儿童能够而且应该预防接种。

(7) 对疫苗成分非过敏敏感症：对疫苗成分（如鸡蛋或新霉素）过敏是真正的预防接种的禁忌证。对疫苗成分的非过敏的敏感症不是疫苗的禁忌证。

(8) 不良反应的家族史：唯一需要确定与儿童预防接种相关的家族史是免疫抑制反应。

(9) 结核菌素 (PPD) 试验：需要做 PPD 试验的儿童能够而且应该免疫，所有疫苗包括 MMR 在做 PPD 皮试当日或之后能够给予接种，大多数疫苗对 PPD 皮试没有任何时间限制。

18.2.4 免疫制剂和疫苗的储藏和使用

一般活疫苗对温度要求较高，通常需要冷藏保存，很多疫苗需要在 2 ~ 8℃保存并且不能被冻结，有些疫苗还需要避光保存。

根据《中华人民共和国药典》(2005 年版）的要求，疫苗瓶开启或冻干疫苗复

溶后，减毒活疫苗应在半小时内用完，灭活疫苗应在1小时内用完，未用完的疫苗要废弃，废弃的疫苗应该专门处理。特别注意按照说明的要求使用疫苗稀释液，液体悬浮疫苗或者重组疫苗在使用之前需要充分混合摇匀。

各种免疫制剂和疫苗储藏和使用的注意事项请参考产品说明书。

18.2.5 接种前告知

接种人员在接种疫苗前应查验儿童预防接种证、卡(薄)，核对受种者姓名、性别，出生年、月、日及接种记录，确认是否为本次受种对象、接种疫苗的品种。对不属于本次的受种者，向儿童家长或其监护人做好说服解释工作。对于因有接种禁忌而不能接种的受种者，医疗卫生人员应当对受种者或者其监护人提出医学建议，并在接种卡（薄）和接种证上记录。

接种人员在实施接种前，应当告知受种者或者其监护人所接种疫苗的品种、作用、禁忌、不良反应以及注意事项。告知可采取口头或文字方式。接种人员在实施接种前，应询问受种者的健康状况以及是否有接种禁忌等情况，并如实记录告知和询问情况。

18.2.6 疫苗

伤寒疫苗

【接种对象】主要用于部队、港口、铁路沿线工作人员，下水道、粪便、垃圾处理人员，饮食行业、医务防疫人员及水上居民或有本病流行地区的人群。

【不良反应】局部可出现红肿，有时有寒战、发热或头痛。一般可自行缓解。

【禁忌证】(1) 发热、患严重高血压。心脏疾病、肝脏疾病、肾脏疾病及活动性结核者。(2) 妊娠期、月经期及哺乳期妇女。(3) 有过敏史者。

【制剂与免疫程序】伤寒疫苗 Typhoid Vaccine 本品系用伤寒沙门菌培养后，取菌苔制成悬液，经甲醛杀菌，以PBS稀释制成。为乳白色混悬液，含苯酚防腐剂。免疫程序：于上臂外侧三角肌附着处皮下注射。初次注射本疫苗后，需注射3针，每针间隔7～10日。注射剂量如下：1～6周岁，第1针0.2 ml，第2针0.3 ml，第3针0.3 ml；7～14周岁，第1针0.3 ml，第2针0.5 ml，第3针0.5 ml；14周岁以上，第1针0.5 ml，第2针1.0 ml，第3针1.0 ml。加强注射剂量与第3针相同。

伤寒副伤寒甲联合疫苗 Typhoid and Paratyphoid A Combined Vaccine 本品系用伤寒沙门菌、副伤寒甲型沙门菌分别培养，取菌苔制成悬液，经甲醛杀菌，以PBS稀释制成。为乳白色混悬液，含苯酚防腐剂。免疫程序同伤寒疫苗。

伤寒副伤寒甲乙联合疫苗 Typhoid and Paratyphoid A&B Combined Vaccine 本品系用伤寒沙门菌、副伤寒甲型沙门菌、副伤寒乙型沙门菌分别培养，取菌苔制成悬液，经甲醛杀菌，以PBS稀释制成。为乳白色混悬液，含苯酚防腐剂。免疫程序同伤寒疫苗。

伤寒Vi多糖疫苗 Vi Polysaccharide Typhoid Vaccine 本品系用伤寒沙门菌培养液纯化得Vi多糖，经用PBS稀释制成，为无色澄明液体。免疫程序：上臂外侧三角肌肌内注射；注射1针，剂量为0.5 ml。

脑膜炎球菌疫苗

【接种对象】参见具体疫苗。

【不良反应】本疫苗反应轻微，偶有短暂低热，局部稍有压痛感，可自行缓解。

【禁忌证】(1) 有癫痫、惊厥及过敏者。(2) 患脑部疾患、肾脏病、心脏病及活动性结核者。(3) 患急性传染病及发热者。

【制剂与免疫程序】A群脑膜炎球菌多糖疫苗 Group A Meningococcal Polysaccharide Vaccine 本品系用A群脑膜炎奈瑟菌培养液，经提取获得的荚膜多糖抗原，纯化后加入适宜稳定剂冻干制成，为白色疏松体，复溶后为澄明液体。接种对象为6个月至15周岁少年儿童。免疫程序见18.2。

A群C群脑膜炎球菌多糖疫苗 Group A+C Meningococcal Polysaccharide Vaccine 本品系用A群及C群脑膜炎奈瑟菌培养液，经提纯获得A群及C群多

糖抗原并加入适宜稳定剂后冻干制成的多糖疫苗。成品外观为白色疏松体，加入所附 PBS 后可迅速溶解，溶液澄明无异物。接种对象为 2 周岁以上儿童及成人，在流行区的 2 岁以下儿童可进行应急接种。免疫程序见 18.2。

钩端螺旋体疫苗

【接种对象】流行地区 7 ~ 60 岁的人群。

【不良反应】全身及局部反应一般轻微，偶有发热及局部疼痛、红肿，一般可自行缓解。

【禁忌证】(1) 发热，患急性传染病、严重心脏病、高血压、肝脏疾病、肾脏疾病、神经系统和精神疾病者。(2) 妊娠期、哺乳期妇女。(3) 有过敏史者。(4) 月经期暂缓注射。

【制剂与免疫程序】*钩端螺旋体疫苗* Leptospira Vaccine 本疫苗系用各地区主要的钩端螺旋体流行菌型的菌株，经培养杀菌后制成单价或多价。为微带乳光的液体，含苯酚防腐剂。免疫程序：上臂外侧三角肌附着处皮下注射。共注射 2 针，间隔 7 ~ 10 日。第 1 针注射 0.5 ml，第 2 针注射 1.0 ml。7 ~ 13 周岁用量减半。必要时 7 周岁以下儿童可酌量注射，但不超过成人量的 1/4。

鼠疫疫苗

【接种对象】疫区或通过疫区的人员。

【不良反应】接种后反应轻微，少数人划痕处会出现浸润，一般不影响活动，个别人体温可能稍有升高，一般可自行消退。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、免疫缺陷症及用免疫抑制药治疗者。(2) 妊娠期或 6 个月内的哺乳期妇女。

【制剂与免疫程序】 *皮上划痕用鼠疫活疫苗* Plague Vaccine (Live) for Percutaneous Scarification 本品系用鼠疫菌弱毒菌株经培养后收集菌体，加入稳定剂冻干制成。为白色或淡黄色疏松体，复溶后为均匀悬液。本品仅供皮上划痕用，严禁注射。开启疫苗瓶和接种时，切勿使消毒药接触疫苗。免疫程序：按标示量加入氯化钠注射液溶解。每瓶 20 次人用剂量者加入 1.0 ml，10 次人用剂量者加入 0.5 ml，复溶后的疫苗在 3 小时内用完。在上臂外侧三角肌上部附着处皮上划痕接种。在接种部位上滴加疫苗，每 1 次人用剂量 0.05 ml。用消毒针划成“井”字，划痕长度为 1 ~ 1.5 cm，应以划破表皮稍见血迹为宜。划痕处用针涂压 10 余次，使菌液充分进入划痕内。接种后局部应裸露至少 5 分钟。14 周岁以下儿童，疫苗滴于两处划 2 个“井”字。“井”字间隔 2 ~ 3 cm。接种人员每年应免疫 1 次。

炭疽疫苗

【接种对象】炭疽常发地区人群，皮毛加工与制革个人、放牧员以及其他与牲畜密切接触者。

【不良反应】接种后局部可出现微红，不需处理；极个别者可出现低热，但能自行消退。如出现持续性体温升高，而局部出现脓肿者，应做对症处理。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、严重皮肤病者。(2) 有免疫缺陷症及接受免疫抑制药治疗者。(3) 有严重过敏反应史者。

【注意事项】(1) 本品仅供皮上划痕用，严禁注射。(2) 开启疫苗瓶和接种时，切勿使消毒药接触疫苗。(3) 疫苗有摇不散的菌块或疫苗瓶有裂纹者，均不得使用。(4) 用前应将疫苗充分摇匀。消毒皮肤只可用乙醇，不可用碘酒。(5)疫苗瓶开启后，应于 3 小时内用完，剩余的疫苗应废弃。(6) 剩余疫苗、空疫苗瓶及用具，需用 3% 碱水煮沸消毒 30 分钟。(7) 严禁冻结。

【制剂与免疫程序】*皮上划痕人用炭疽活疫苗* Anthrax Vaccine (Live) for Percutaneous Scarification 本品系用炭疽芽胞杆菌的弱毒株经培养、收集菌体后稀释制成。为灰白色均匀悬液。免疫程序：在上臂外侧三角肌附着处皮上划痕接种。用消毒注射器吸取疫苗，在接种部位滴 2 滴，间隔 3 ~ 4 cm，划痕时用手将皮肤绷紧，用消毒划痕针在每滴疫苗处做“井”字划痕，每条痕长为 1 ~ 1.5 cm。划破表皮以出现间断小血点为度。用同一划痕针反复涂压，使疫苗充分进入划痕处，接种后局部至少应裸露 5 ~ 10 分钟，然后

用消毒干棉球擦净。接种后24小时划痕部位无任何反应者应重新接种。

布氏菌疫苗

【接种对象】与布氏菌病传染源有密切接触者，每年应免疫1次。布氏菌素反应阳性者可不予接种。

【不良反应】接种后局部反应轻微，少数人划痕处会出现轻度浸润，一般不影响活动。个别人体温稍有增高，一般可自行消退。如因使用途径错误，出现类似急性布氏菌病症状者，要按急性布氏菌病进行彻底治疗。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、免疫缺陷症及接受免疫抑制治疗者。(2) 妊娠期及6个月内的哺乳期妇女。

【注意事项】(1) 本品仅供皮上划痕用，严禁注射。(2) 开启疫苗瓶和接种时，切勿使消毒药接触疫苗。(3) 疫苗瓶有裂纹或标签不清者，均不得使用。

【制剂与免疫程序】*皮上划痕人用布氏菌活疫苗* Brucellosis Vaccine (Live) for Percutaneous Scarification 本品系用布氏菌的弱毒菌株经培养、收集菌体加入稳定剂后冻干制成。为乳白色疏松体，复溶后为均匀悬液。免疫程序：每瓶加入0.5 ml氯化钠注射液，复溶后的疫苗应在3小时内用完，剩余的疫苗应作废。上臂外侧三角肌上部附着处皮上划痕接种。在接种部位滴加疫苗，每1次人用剂量0.05 ml，应以划破表皮微见血迹为宜。划痕处用针涂压10余次，使菌苗充分进入划痕内。接种后局部应裸露至少5分钟。10岁以下儿童及复种者疫苗滴于一处划1个“井”字，10岁以上初种者疫苗滴于两处划2个“井”字，间隔2～3 cm。

卡介苗

【接种对象】出生3个月以内的婴儿或用5U PPD试验阴性的儿童（PPD试验后48～72小时局部硬结在5 mm以下者为阴性）。

【不良反应】接种后2周左右，局部可出现红肿浸润，若随后化脓，形成小溃疡，可用1%甲紫涂抹，以防感染。一般8～12周后结痂，如遇局部淋巴结肿大软化形成脓疱，应及时诊治。

【禁忌证】(1) 患结核病、急性传染病、肾炎、心脏病者。(2) 患湿疹或其他皮肤病者。(3) 患免疫缺陷症者。

【注意事项】(1) 严禁皮下或肌内注射。(2) 疫苗瓶有裂纹者不得使用。(3) 接种对象必须详细登记姓名、性别、年龄、住址、疫苗批号及亚批号、制造单位和接种日期。(4) 接种卡介苗的注射器针头要专用，不得用作其他注射，以防止发生化脓反应。(5) 使用时卡介苗应注意避光。

【制剂与免疫程序】*皮内注射用卡介苗* BCG Vaccine for Intradermal Injection 本品系用卡介菌经培养后收集菌体，加入稳定剂冻干制成。为白色疏松体或粉末，复溶后为均匀悬液。免疫程序参考18.2。

白喉疫苗

【接种对象】参考具体疫苗。

【不良反应】注射本品后局部可有红肿、疼痛、发痒或有低热、疲倦、头痛等，一般不需要特殊处理即可消退，如有严重反应及时诊治。

【禁忌证】(1) 有癫痫、神经系统疾病及惊厥者。(2)急性传染病(包括恢复期)及发热者，暂缓注射。(3) 有过敏史者。

【注意事项】(1) 使用时应充分摇匀，如出现摇不散之凝块、异物、疫苗曾经冻结、疫苗瓶有裂纹或标签不清者，均不得使用。(2) 注射后局部可能有硬结，1～2个月即可吸收，注射第2针时应换另侧部位。(3) 应备有肾上腺素等药物，以备偶有发生严重过敏反应时急救用。接受注射者在注射后应在现场休息片刻。(4) 严禁冻结。

【制剂与免疫程序】*吸附白喉疫苗* Diphtheria Vaccine, Adsorbed 白喉疫苗是用白喉杆菌菌种，在适宜的培养基中产生的毒素经甲醛脱毒、精制，加入氢氧化铝佐剂制成。为白色均匀悬液，长时间放置后佐剂下沉，溶液上层无色澄明，但经振摇后能均匀分散，含防腐剂。接种对象为6个月至12岁儿童。免疫程序：(1) 上臂三角肌肌内注射。(2) 剂量如下（表18-3）。

表 18-3 吸附白喉疫苗的免疫剂量

	年 份	针 次	剂量(ml)
全程免疫	第 1 年	第 1 针(间隔 4 ~ 8 周)	0.5
		第 2 针	0.5
	第 2 年	注射 1 针	0.5
加强免疫	3 ~ 5 年后	加强 1 针	0.5

吸附白喉疫苗(成人及青少年用) Diphtheria Vaccine for Adults and Adolescents, Adsorbed 本品系由白喉类毒素原液加入氢氧化铝佐剂制成。为乳白色均匀混悬液，长时间放置佐剂下沉，溶液上层应无色澄明，但经振摇后能均匀分散，含防腐剂。接种对象为 12 岁以上的人群。免疫程序：注射 1 次，注射剂量 0.5 ml。

吸附白喉破伤风联合疫苗 Diphtheria Tetanus Combined Vaccine, Adsorbed 本品系用白喉类毒素原液和破伤风类毒素原液加入氢氧化铝佐剂制成。为乳白色均匀悬液，长时间放置佐剂下沉，溶液上层应无色澄明，但经振摇后能均匀分散，含防腐剂硫柳汞。接种对象为 12 岁以下儿童。免疫程序参考 18.2。

吸附白喉破伤风联合疫苗(成人和青少年用) Diphtheria Tetanus Combined Vaccine for Adults and Adolescent, Adsorbed 本品系用白喉类毒素原液和破伤风类毒素原液加入氢氧化铝佐剂制成。应为乳白色均匀悬液，长时间放置佐剂下沉，溶液上层应无色澄明，但经振摇后能均匀分散，含防腐剂硫柳汞。接种对象为 12 岁以上人群。免疫程序：注射 1 次，注射剂量 0.5 ml。上臂三角肌肌内注射。

吸附百日咳白喉联合疫苗 Diphtheria Pertussis Combined Vaccine, Adsorbed 本品系由百日咳疫苗原液和白喉类毒素原液加氢氧化铝佐剂制成。为乳白色悬液，放置后佐剂下沉，摇动后即成均匀悬液，含防腐剂。接种对象为 3 个月至 6 周岁的儿童。免疫程序：注射剂量 0.5 ml。臀部或上臂外侧三角肌肌内注射。

吸附百白破联合疫苗 Diphtheria, Tetanus and Pertussis Combined Vaccine, Adsorbed 本品系由百日咳疫苗原液、白喉类毒素原液及破伤风类毒素原液加氢氧化铝佐剂制成。为乳白色悬液，放置后佐剂下沉，摇动后即成均匀悬液，含防腐剂。接种对象为 3 月龄至 6 周岁儿童。免疫程序参考 18.2。臀部或上臂外侧三角肌肌内注射。

吸附无细胞百白破联合疫苗 Diphtheria, Tetanus and Acellular Pertussis Combined Vaccine, Adsorbed 本品系由百日咳疫苗原液、白喉类毒素原液及破伤风类毒素原液加氢氧化铝佐剂制成。为乳白色悬液，放置后佐剂下沉，摇动后即成均匀悬液，含防腐剂。接种对象为 3 月龄至 6 周岁儿童。免疫程序参考 18.2。臀部外上方 1/4 处或上臂外侧三角肌附着处皮肤经消毒后肌内注射。

吸附无细胞百白破联合疫苗(青少年用) Diphtheria, Tetanus and Acellular Pertussis Combined Vaccine for Adolescent, Absorbed

【接种对象】【不良反应】【禁忌证】【注意事项】【制剂与免疫程序】参见说明书。

破伤风疫苗

【接种对象】参考具体疫苗。

【不良反应】注射本品后局部可有红肿、疼痛、发痒或有低热、疲倦、头痛等，一般不需处理即自行消退。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、发热者。(2) 有过敏史者。(3) 注射破伤风类毒素后发生神经系统反应者。

【注意事项】(1) 使用时应充分摇匀，如出现摇不散之凝块、异物、疫苗曾经冻结、疫苗瓶有裂纹或标签不清者，均不得使用。(2) 注射后局部可能有硬结，1 ~ 2 个月即可吸收，注射第 2 针时应换另侧部位。(3) 应备有肾上腺素等药物，以备

偶有发生严重过敏反应时急救用。接受注射者在注射后应在现场休息片刻。（4）严禁冻结。

【制剂与免疫程序】吸附破伤风疫苗 Tetanus Vaccine, Adsorbed　本品系用破伤风梭状芽胞杆菌菌种，在适宜的培养基中培养产生的毒素经甲醛脱毒、精制，加入氢氧化铝佐剂制成。为乳白色均匀混悬液，长时间放置佐剂下沉，溶液上层应无色澄明，但经振摇后能均匀分散，含防腐剂。接种对象主要是发生创伤机会较多的人群，妊娠期妇女接种本品可预防产妇及新生儿破伤风。免疫程序：①无破伤风类毒素免疫史者按表 18-4 方法进行全程免疫。②经全程免疫和加强免疫之人员，自最后 1 次注射后 3 年以内受伤时，不需注射本品。超过 3 年者，用本品加强注射 1 次。严重污染的创伤或受伤前未经全程免疫者，除注射本品外，可酌情在另一部位注射破伤风抗毒素或破伤风人免疫球蛋白。③用含破伤风类毒素的混合制剂做过全程免疫者，以后每 10 年用本品加强注射 1 针即可（表 18-4）。妊娠期妇女可在妊娠第 4 个月注射第 1 针，6 ~ 7 个月时注射第 2 针，每 1 次注射 0.5 ml。多价疫苗参考白喉疫苗。

百日咳疫苗　无单价疫苗，多价疫苗参考白喉疫苗。

乙型脑炎疫苗

【接种对象】6 月龄至 10 周岁儿童和由非疫区进入疫区的儿童和成人。

【不良反应】个别出现头晕和一过性发热反应，一般不超过 2 日，可自行缓解。偶有散在皮疹出现，一般不需特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】（1）发热，患急性疾病、严重慢性疾病或体质衰弱者。（2）对药物或食物有过敏史者。（3）有惊厥史者。

【制剂与免疫程序】乙型脑炎灭活疫苗 Japanese Encephalitis Vaccine, Inactivated　本品系用乙脑病毒接种地鼠肾细胞，经培养、收获、灭活病毒后制成。为橘红色澄明液体，含硫柳汞防腐剂。免疫程序参考 18.2。

乙型脑炎灭活疫苗（Vero 细胞）Japanese Encephalitis Vaccine (Vero Cell), Inactivated　本品系用乙脑病毒接种 Vero 细胞，经培养、收获、灭活病毒后，浓缩、纯化、冻干制成。为白色疏松，复溶后为澄明液体，冻干保护剂主要成分为人血白蛋白、明胶和麦芽糖。免疫程序参考 18.2。

乙型脑炎减毒活疫苗　Japanese Encephalitis Vaccine, Live　本品系用流行性乙型脑炎病毒 SA14-14-2 减毒株接种原代地鼠肾细胞，经培养、收获病毒液，加适宜稳定剂冻干制成。为淡黄色疏松体，复溶后为橘红色或粉红色澄明液体。免疫程序参考 18.2。

肾综合征出血热疫苗

【接种对象】肾综合征出血热疫区的居民及进入该地区的人员，主要对象为 10 ~ 60 岁的高危人群。

【不良反应】个别有发热、头晕、皮疹者应注意观察，必要时给予适当治疗。因疫苗含有氢氧化铝佐剂，少数人在注射后局部可出现硬结、轻度肿胀和疼痛，一般在 1 ~ 3 日自行消退。

【禁忌证】（1）发热，患急性疾病，严重慢性疾病、神经系统疾病者。（2）患过敏性疾病、对抗生素或生物制品有过敏史者。（3）哺乳期、妊娠期妇女。

【制剂与免疫程序】Ⅰ型肾综合征出血热灭活疫苗 Haemorrhagic Fever

表 18-4　吸附破伤风疫苗免疫剂量

	年份	针次	剂量（ml）
全程免疫	第 1 年	第 1 针（间隔 4 ~ 8 周）	0.5
		第 2 针	0.5
	第 2 年	注射 1 针	0.5
加强免疫	一般每 10 年加强注射 1 针，如遇有特殊情况也可 5 年加强 1 针		

With Renal Syndrome (Type Ⅰ) Vaccine, Inactivated 本品系用Ⅰ型肾综合征出血热病毒接种原代沙鼠肾细胞，经培养、收获病毒液、灭活病毒，加人氢氧化铝佐剂制成。为橘红色微浑浊液体，含硫柳汞防腐剂。免疫程序：基础免疫3针，于第0日，第7日、第28日各注射1次；基础免疫后1年应加强免疫1次，每次1.0 ml。

Ⅱ型肾综合征出血热灭活疫苗 Haemorrhagic Fever With Renal Syndrome (Type Ⅱ) Vaccine, Inactivated 本品系用Ⅱ型肾综合征出血热病毒接种原代地鼠肾细胞，经培养、收获病毒液、灭活病毒，加人氢氧化铝佐剂制成。为橘红色微浑浊液体，含硫柳汞防腐剂。免疫程序：基础免疫3针，于第0日、第14日、第28日各注射1次。基础免疫后1年应加强免疫1针，每1次1.0 ml。

双价肾综合征出血热灭活疫苗 Haemorrhagic Fever With Renal Syndrome Bivalent Vaccine, Inactivated 本品系用Ⅰ型和Ⅱ型肾综合征出血热病毒接种原代地鼠肾细胞，经培养、收获病毒液、灭活病毒、纯化，混合后加入人白蛋白保护剂和氢氧化铝佐剂制成，为橘红色半微浑浊液体，含硫柳汞防腐剂。免疫程序：基础免疫为2针，于第0日、第14日各注射1次。基础免疫后6个月加强免疫1针，每次1.0 ml。

狂犬病疫苗

【接种对象】凡被狂犬或其他疯动物咬伤、抓伤时，不分年龄、性别均应立即处理局部伤口（用清水或肥皂水反复冲洗后再用碘酊或乙醇消毒数次），并及时按暴露后免疫程序注射本疫苗；凡有接触狂犬病病毒危险的人员（如兽医、动物饲养员、林业从业人员、屠宰场工人、狂犬病实验人员等），按暴露前免疫程序预防接种。

【不良反应】注射后有轻微局部及全身反应，可自行缓解，偶有皮疹。若有速发型过敏反应、神经性水肿、荨麻疹等较严重不良反应者，可做对症治疗。

【禁忌证】(1) 由于狂犬病是致死性疾病，暴露后程序接种疫苗无任何禁忌证。(2) 暴露前程序接种时遇发热、急性疾病、严重慢性疾病、神经系统疾病、过敏性疾病或对抗生素、生物制品有过敏反应者禁用。哺乳期、妊娠期妇女建议推迟注射本疫苗。

【制剂与免疫程序】人用狂犬病疫苗（Vero细胞） Rabies Vaccine (Vero Cell) for Human Use 本品系用狂犬病病毒固定毒株接种Vero细胞，培养后，收获病毒液，经灭活病毒、浓缩、纯化，加入适宜的稳定剂，可加人氢氧化铝佐剂制成。为乳白色浑浊液体，含硫柳汞防腐剂。于2～8℃避光保存和运输。免疫程序：(1) 使用前将疫苗振摇成均匀悬液。(2) 于上臂三角肌肌内注射，幼儿可在大腿前外侧区肌内注射。(3) 暴露后免疫程序为一般咬伤者于0日（第1日，当日）、3日（第4日，以下类推）、7日、14、28日各注射本疫苗1剂，共5针，儿童用量相同。对有下列情形之一的建议首剂狂犬病疫苗剂量加倍给予：①注射疫苗前1个月内注射过免疫球蛋白或抗血清者。②先天性或获得性免疫缺陷患者。③接受免疫抑制药（包括抗疟疾药物）治疗的患者。④老年人及患慢性病者。⑤于暴露后48小时或更长时间后才注射狂犬病疫苗的人员。暴露后免疫程序按下述伤及程度分级处理：Ⅰ级暴露，触摸动物，被动物舔及无破损皮肤，一般不需处理，不必注射狂犬病疫苗。Ⅱ级暴露，未出血的皮肤咬伤、抓伤，破损的皮肤被舔及，应按暴露后免疫程序接种狂犬病疫苗。Ⅲ级暴露，一处或多处皮肤出血性咬伤或被抓伤出血，可疑或确诊的疯动物唾液污染黏膜，应按暴露后程序立即接种狂犬病疫苗和抗血清或免疫球蛋白。抗狂犬病血清按40 U/kg给予，或狂犬患者免疫球蛋白按20 U/kg给予，将尽可能多的抗狂犬病血清或狂犬患者免疫球蛋白于咬伤局部浸润注射，剩余部分肌内注射。(4) 暴露前免疫程序。按第0日、7日、28日接种，共接种3针。(5) 对曾经接种过狂犬病疫苗的一般患者再需接种疫苗的建议：① 1年内进行过全程免疫，被可疑疯动物咬伤者，应于第0日和第3日各接种1剂疫苗。② 1年前进

行过全程免疫，被可疑疯动物咬伤者，则应全程接种疫苗。③ 3 年内进行过全程免疫，并且进行过加强免疫，被可疑动物咬伤者，于第 0 日和第 3 日各接种 1 剂疫苗。④进行过全程免疫，并且进行过加强免疫但超过 3 年，被可疑疯动物咬伤者，则应全程接种疫苗。

冻干人用狂犬病疫苗（Vero 细胞） Rabies Vaccine (Vero Cell) for Human Use, Freeze-dried 本品系用狂犬病病毒固定毒株接种 Vero 细胞，培养后，收获病毒液，经灭活病毒、浓缩、纯化，加入适宜的稳定剂冻干制成。为白色疏松体，复溶后为澄明液体，含硫柳汞防腐剂。免疫程序同人用狂犬病疫苗（Vero 细胞）。

人用狂犬病疫苗（地鼠肾细胞） Rabies Vaccine (Hamster Kidney Cell) for Human Use 本品系用狂犬病病毒固定毒株接种原代地鼠肾细胞，培养后，收获病毒液，经灭活病毒、浓缩、纯化，加入适宜的稳定剂，可加入氢氧化铝佐剂制成。含佐剂疫苗为乳白色浑浊液体，不含佐剂疫苗为无色澄明液体，含硫柳汞防腐剂。免疫程序同人用狂犬病疫苗（Vero 细胞）。

麻疹疫苗

【接种对象】8 月龄以上的麻疹易感者。

【不良反应】在 6 ~ 10 日，少数儿童可能出现一过性发热反应以及散在皮疹，一般不超过 2 日可自行缓解，通常不需特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、急性或慢性感染者、发热者。(2) 对鸡蛋有过敏史者。(3) 妊娠期妇女。

【制剂与免疫程序】*麻疹减毒活疫苗* Measles Vaccine, Live 本品系用麻疹病毒减毒株接种原代鸡胚细胞，经培养、收获病毒液，加入适宜稳定剂冻干制成。为乳酪色疏松体，复溶后为橘红色或淡粉红色澄明液体。免疫程序见 18.2。

麻疹腮腺炎联合减毒活疫苗 Measles and Mumps Combined Vaccine, Live 本品系用麻疹病毒减毒株和腮腺炎病毒减毒株分别接种原代鸡胚细胞，经培养、收获病毒液，按比例混合配置，加适宜稳定剂冻干制成。为乳酪色疏松体，复融后为橘红色澄明液体。免疫程序见预防接种总论。

麻疹风疹腮腺炎联合疫苗 Measles, Mumps and Rubella Vaccine, Live 本品是一种无菌冻干制品，外观为乳酪色疏松体，溶解后为橘红色澄明液体。制品内含三种病毒成分：麻疹病毒系用麻疹病毒减毒株接种于 SPF 鸡胚细胞，经培育后收获病毒；腮腺炎病毒系用腮腺炎减毒株接种于 SPF 鸡胚细胞，经培育后收获病毒；风疹病毒系用风疹减毒株接种于人二倍体细胞（2BS 株），经培育后收获病毒。三种病毒混合并加入适宜稳定剂后冻干制成。用于预防麻疹、腮腺炎和风疹 3 种疾病。免疫程序见 18.2。

风疹疫苗

【接种对象】8 月龄以上的风疹易感者。

【不良反应】在 6 ~ 11 日，个别人可能出现一过性发热反应及轻微皮疹，一般不超过 2 日可自行缓解；成人接种后 2 ~ 4 周，个别人可能出现轻度关节反应，一般不需要特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、发热者。(2) 对有过敏史者。(3) 妊娠期妇女。

【制剂与免疫程序】*风疹减毒活疫苗（人二倍体细胞）* Rubella Vaccine (Human Diploid Cell), Live 本品系用风疹病毒减毒株接种人二倍体细胞，经培养、收获病毒液，加入适宜稳定剂冻干制成。为乳酪色疏松体，复溶后应为橘红色澄明液体。免疫程序见 18.2。

风疹减毒活疫苗（兔肾细胞） Rubella Vaccine (Rabbit Kidney Cell), Live 本品系用风疹病毒减毒株接种原代兔肾细胞，经培养、收获病毒液，加适宜稳定剂冻干制成。为乳酪色疏松体，复溶后为橘红色澄明液体。免疫程序见 18.2。

多价疫苗 参考麻疹疫苗。

腮腺炎疫苗

【接种对象】8 月龄以上的腮腺炎易感者。

【不良反应】在6～10日，少数儿童可能出现一过性发热反应及轻微皮疹，一般不超过2日可自行缓解，通常不需特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 患严重疾病、急性或慢性感染、发热者。(2)对鸡蛋有过敏史者。(3) 妊娠期妇女。

【制剂与免疫程序】*腮腺炎减毒活疫苗* Mumps Vaccine,Live 本品系用腮腺炎病毒减毒株接种原代鸡胚细胞，经培养、收获病毒液，加适宜稳定剂冻干制成。为乳酪色疏松体，复溶后应为橘红色或淡粉红色澄明液体。免疫程序见18.2。

多价疫苗 参考麻疹疫苗。

流感疫苗

【接种对象】8月龄以上的腮腺炎易感者。

【不良反应】少数人注射后12～24小时注射部位出现红、肿、痛、触痛和痒等，一般可很快消失，不影响正常活动。少数人出现肌肉疼痛、关节疼痛、头痛、不适和发热等全身反应。过敏反应一般出现于对鸡蛋蛋白过敏者。

【禁忌证】(1) 发热、患急性疾病及感冒者。(2) 有吉兰-巴雷综合征病史者。(3) 对鸡蛋过敏或有其他过敏史者。(4) 妊娠期妇女。

【注意事项】(1) 严禁静脉注射。(2) 注射后出现任何神经系统反应者，禁止再次使用。(3) 疫苗中有异物、有摇不散的沉淀，疫苗瓶有裂纹或标签不清者，均不得使用。(4) 应备有肾上腺素等药物，以备偶有发生严重过敏反应时急救用。接受注射者在注射后应在现场休息片刻。(5) 严禁冻结。

【制剂与免疫程序】*流感全病毒灭活疫苗* Influenza Vaccine (Whole Virion), Inactivated 本品系用甲型和乙型流行性感冒病毒当年的流行株或相似株，分别接种鸡胚，经培养、收获病毒液、灭活、浓缩、纯化后制成。

流感病毒裂解疫苗 Influenza Vaccine (Split Virion), Inactivated 本品系用世界卫生组织（WHO）推荐的、经国家食品药品监督管理局批准的流行性感冒病毒当年流行株，分别接种鸡胚培养，收获的病毒液经浓缩、裂解和纯化后制成的裂解疫苗。为轻微乳白色液体，含硫柳汞防腐剂。

b型流感嗜血杆菌结合疫苗

【接种对象】【不良反应】【禁忌证】【注意事项】【制剂与免疫程序】参见说明书。

乙型肝炎疫苗

【接种对象】本疫苗适用于乙型肝炎易感者，尤其下列人员：(1) 新生儿，特别是母亲为HBsAg、HBeAg阳性者；(2) 从事医疗工作的医护人员及接触血液的实验人员。

【不良反应】个别人可有注射部位疼痛、红肿或中、低度发热，一般不需特殊处理，可自行缓解，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 发热、患急性或慢性严重疾病者。(2) 对酵母成分过敏者。

【制剂与免疫程序】*重组乙型肝炎疫苗(酵母)* Hepatitis B Vaccine Made by Recombinant DNA Techniques in Yeast 本品系由重组酵母表达得乙型肝炎病毒表面抗原（HBsAg）经纯化，加氢氧化铝佐剂制成。为乳白色混悬液体，可因沉淀而分层，易摇散。免疫程序：基础免疫程序为3针，分别在第0个月、第1个月、第6个月接种。新生儿第1针在出生后24小时内注射。16岁以下人群每1次剂量为5μg，16岁或16岁以上人群每1次剂量为10μg。

重组乙型肝炎疫苗（汉逊酵母） Recombinant Hepatitis B Vaccine (Yeast) 本品系由重组汉逊酵母表达的乙型肝炎病毒表面抗原（HBsAg）经纯化，加佐剂吸附后制成。疫苗为白色混悬液体，可因沉淀而分层，易摇散。不应有摇不散的块状物。免疫程序参考18.2。

重组乙型肝炎疫苗（CHO细胞） Hepatitis B Vaccine Made by Recombinant DNA Techniques in CHO Cell 本品系由重组CHO细胞表达的乙型肝炎病毒表面抗原（HBsAg）经纯化，加入氢氧化铝佐剂制成。为乳白色悬浊液体，可因沉淀而分层，易摇散，含硫柳汞防腐剂。免疫程序：基础免疫程序为3针，分

别在第0个月，第1个月，第6个月接种。新生儿第1针在出生后24小时内注射。一般易感者使用每瓶10μg，母婴阻断的新生儿使用每瓶20μg。

甲乙型肝炎联合疫苗 Hepatitis A and B Combined Vaccine 本品系由氢氧化铝吸附的纯化灭活甲型肝炎病毒和重组（酵母）表达的纯化乙肝表明抗原（HBsAg）混合而成，为白色混悬液体，可因沉淀而分层，易摇散，不应有摇不散的块状物。本品含灭活甲肝病毒抗原、重组HBsAg、氢氧化铝、氯化钠和注射用水。免疫程序见18.2。

甲型肝炎疫苗

【接种对象】甲肝减毒活疫苗为1.5岁以上的甲型肝炎易感者。灭活疫苗为甲肝易感者。

【不良反应】注射疫苗后少数可能出现局部疼痛、红肿，一般在72小时内自行缓解。偶有皮疹出现，不需特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 身体不适，腋温超过37.5℃者。(2) 患急性传染病或其他严重疾病者。(3) 免疫缺陷或接受免疫抑制药治疗者。(4) 过敏体质者。

【制剂与免疫程序】*甲型肝炎减毒活疫苗* Hepatitis A Virus Vaccine，Live 本品系用甲型肝炎病毒减毒株接种人二倍体细胞，经培养、收获病毒液、提纯制成。为澄明液体。免疫程序参考预防接种总论。

冻干甲型肝炎减毒活疫苗 Hepatitis A (Live) Virus Vaccine，Freezedried 本品系用甲型肝炎病毒减毒株接种人二倍体细胞，经培养、收获病毒液、提纯，加适宜的稳定剂冻干制成。为乳酪色疏松体，复溶后为澄明液体。免疫程序参考18.2。

甲肝灭活疫苗 Inactitaved Hepatitis A Virus Vaccine 本品系用甲型肝炎病毒株接种人胚肺二倍体细胞株，经培养繁殖、收获、提纯、甲醛灭活和氢氧化铝吸附制成。本品为有微量乳白色沉淀的液体，含有甲肝病毒抗原、氢氧化铝、磷酸氢二钠、磷酸二氢钠、氯化钠、注射用水等。不含防腐剂。免疫程序参考18.2。

联合疫苗 参考乙型肝炎疫苗。

脊髓灰质炎疫苗

【接种对象】主要为2月龄以上的儿童。

【不良反应】个别人有发热、恶心、呕吐、腹泻和皮疹。一般不需特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 发热、患急性传染病者。(2) 患免疫缺陷症、接受免疫抑制药治疗者。(3) 妊娠期妇女。

【制剂与免疫程序】*脊髓灰质炎减毒活疫苗糖丸（人二倍体细胞）* Poliomyelitis Vaccine in Dragee Candy (Human Diploid Cell), Live 本品系用脊髓灰质炎病毒Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ型减毒株分别接种在人二倍体细胞，经培养、收获病毒液后制成，为白色固体糖丸。免疫程序参考18.2。

口服脊髓灰质炎减毒活疫苗（猴肾细胞） Poliomyelitis (Live)Vaccine (Monkey Kidney Cell),Oral 本品系用脊髓灰质炎病毒Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ型减毒株分别接种于原代猴肾细胞，经培养、收获病毒液制成。为橘红色液体。免疫程序参考18.2。

脊髓灰质炎减毒活疫苗糖丸（猴肾细胞） Poliomyelitis Vaccine in Dragee Candy (Monkey Kidney Cell), Live 本品系用脊髓灰质炎病毒Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ型减毒株分别接种于原代猴肾细胞，经培养、收获病毒液后制成，为白色固体糖丸。免疫程序参考18.2。

水痘疫苗

【接种对象】年龄为1岁以上的水痘易感者，主要用于健康儿童。

【不良反应】在6～18日时，少数人可有短暂发热、轻微皮疹或疱疹，一般不需特殊处理，必要时可对症治疗。

【禁忌证】(1) 患严重疾病（急性或慢性感染）、发热者。(2) 对疫苗任何成分过敏者禁用。

【制剂与免疫程序】*水痘减毒活疫苗* Varicella Vaccine,Live 本品系用水痘-带状疱疹病毒Oka株接种人二倍体细胞MRC-5株，经培养，收获病毒并加适宜

稳定剂后冻干制成，为乳白色疏松体。免疫程序参考说明书。

轮状病毒疫苗

【接种对象】本疫苗主要用于2个月至3岁婴幼儿。

【不良反应】偶有发热、呕吐、腹泻等轻微反应，多为一过性，一般无需特殊处理。必要时给予对症治疗。

【禁忌证】(1) 身体不适，发热，腋温37.5℃以上者。(2) 急性传染病或其他严重疾病患者。(3) 免疫缺陷和接受免疫抑制治疗者。

【制剂与免疫程序】**口服轮状病毒活疫苗** Live Rotavirus Vaccine, Oral 口服轮状病毒活疫苗系采用轮状病毒减毒株感染新生小牛肾细胞，经培育、收获病毒液后加入适宜的甜味保护剂制成，为橙红或粉红色澄清液体。免疫程序参考说明书。

肺炎球菌疫苗

【接种对象】用于2岁以上如下人群的接种：(1) 选择性接种。50岁及超过50岁以上者；患有可增加肺炎球菌感染性疾病危险的慢性疾病者，如心血管疾病、肺部疾患、肝及肾脏功能受损者；免疫缺陷患者，如脾切除者或是由镰状细胞性疾病及其他原因引起的脾功能障碍者；患有其他慢性疾病而可能感染肺炎球菌的高危人群（如乙醇滥用）及并存如糖尿病、慢性脑脊髓液渗漏、免疫抑制等因此可引起更严重的肺炎球菌病患者，或是反复发作的上呼吸道疾病，包括中耳炎、鼻旁窦炎等；霍奇金病患者。(2) 群体接种。群体接触密切者，如寄宿学校、养老院及其他相似场所；具有发生流行性感冒并发症高度危险者，特别是肺炎；当疫苗中含有的某型肺炎球菌在社区人群中发生暴发流行时，社区人群为高危人群。(3) 再接种。一般无需对成年人常规再接种；脾切除者；10岁以下脾切除或患有镰状细胞性贫血症的儿童。

【不良反应】(1) 可能在注射部位出现暂时的疼痛、红肿、硬结和短暂的全身发热反应等轻微反应，一般均可自行缓解。必要时可给予对症治疗。罕见的不良反应有头痛、不适、虚弱乏力、淋巴结炎、过敏样反应，血清病，关节痛，肌痛，皮疹，荨麻疹。对稳定的特发性血小板减少性紫癜的患者，会极偶然地在接种后的2～14日血小板减少复发，并可持续2周。在接种肺炎双球菌疫苗的人群中，也罕有神经系统异常的报道，如感觉异常、急性神经根病变等，但与其因果关系尚未被证实。(2) 因对疫苗成分过敏而引起的急性反应，应注射1：1 000的肾上腺素。

【禁忌证】(1) 对疫苗中任何成分过敏者禁用本品。(2) 除接种对象项目中所列适用者外，均禁止接种本品。

【制剂与免疫程序】**23价肺炎球菌多糖疫苗** 23-Valent Pneumococcal Polysac-charide Vaccine 本品系采用23种最广泛流行、最具侵袭性的血清型肺炎球菌，包括血清型1、2、3、4、5、6B、7F、8、9N、9V、10A、11A、12F、14、15B、17F、18C、19A、19F、20、22F、23F和33F，经培养，提纯制成的多糖疫苗。成品为无色、透明的液体注射剂。含0.25%苯酚作防腐剂。于2～8℃避光保存和运输。免疫程序：上臂外侧三角肌皮下或肌内注射，一次注射0.5 ml。①霍奇金病患者如需接种疫苗可在治疗开始前10日给予。如果进行放疗或化疗至少应在开始前14日给予，以产生最有效的抗体免疫应答。治疗开始前不足10日及治疗期间不主张预防接种。②免疫缺陷患者，应于术前2周接种。③脾切除者，每5年加强免疫1次，一次注射剂量0.5 ml。④对10岁以下脾切除或患有镰状细胞性贫血的儿童，应每隔3～5年加强免疫1次，一次注射0.5 ml。

18.3 免疫制剂

免疫制剂可分为免疫球蛋白和抗血清。

18.3.1 免疫球蛋白

免疫球蛋白从免疫人体或动物的血浆或血清中提取，经检测乙肝表面抗原阴性，丙肝抗体阴性、人类免疫缺陷病毒（HIV_1、HIV_2）阴性的免疫制剂。免疫球蛋白可分为同源人类免疫球蛋白和其他免疫球蛋

白。同源人类免疫球蛋白是以人体的血液或血清中提取的，通常有两种类型，即同源人类抗体／免疫球蛋白、同源人类高价免疫球蛋白。接种免疫球蛋白可短时间内产生保护作用，这种保护作用能够持续数周时间。

人血白蛋白[保(乙)]

Human Serum Albumin

【适应证】(1) 失血创伤、烧伤引起的休克。(2) 脑水肿及损伤引起的颅压升高。(3) 肝硬化及肾病引起的水肿或腹水。(4) 低蛋白血症的防治。(5) 新生儿高胆红素血症。(6) 用于心肺分流术、烧伤的辅助治疗、血液透析的辅助治疗和成人呼吸窘迫综合征。

【注意事项】(1) 药液呈现混浊、沉淀、异物或瓶子有裂纹、瓶盖松动、过期失效等情况不可使用。(2) 本品开启后，应一次输注完毕，不得分次或给第二人输用。(3) 输注过程中如发现患者有不适反应，应立即停止输用。(4) 有明显脱水者应同时补液。(5) 运输及贮存过程中严禁冻结。(6) 对孕妇或可能妊娠妇女的用药应慎重，如有必要应用时，应在医师指导和严密观察下使用。

【禁忌证】(1) 对白蛋白有严重过敏者。(2) 高血压患者、急性心脏病者、正常血容量及高血容量的心力衰竭患者。(3) 严重贫血患者。(4) 肾功能不全者。

【不良反应】使用本品一般不会产生不良反应，偶可出现寒战、发热、颜面潮红、皮疹、恶心呕吐等症状，快速输注可引起血管超负荷导致肺水肿，偶有变态反应。

【用法与用量】(1) 用法：一般采用静脉滴注或静脉注射。为防止大量注射时机体组织脱水，可采用 5% 葡萄糖注射液或氯化钠注射液适当稀释作静脉滴注（宜用备有滤网装置的输血器）。滴注速度应以每分钟不超过 2 ml 为宜，但在开始 15 分钟内，应特别注意速度缓慢，逐渐加速至上述速度。(2) 用量：使用剂量由医师酌情考虑，一般因严重烧伤或失血等所致休克，可直接注射本品 5 ~ 10 g，隔 4 ~ 6 小时重复注射 1 次。在治疗肾病及肝硬化等慢性白蛋白缺乏症时，可每日注射本品 5 ~ 10 g，直至水肿消失，血清白蛋白含量恢复正常为止。

【制剂与规格】人血白蛋白注射液：① 20%，25 ml；② 20%，50 ml；③ 25%，50 ml。

冻干人血白蛋白：① 5 g；② 10 g。

18.3.1.1 同源人类抗体／免疫球蛋白

同源人类抗体／免疫球蛋白由许多成年捐献者的 IgG 抗体片段组成，主要用于甲肝和麻疹暴露后的初步预防。由于它来自许多不同的捐献者，因此含有针对许多不同抗原的抗体，如麻疹抗体、腮腺炎抗体、水痘抗体、甲肝抗体和其他正在人群中流行疾病的抗体。

(1) 适应证和用法：同源人类抗体／免疫球蛋白可以通过肌内注射途径用于甲肝、麻疹、风疹暴露后的预防。静脉注射同源人类抗体／免疫球蛋白可用于先天丙种球蛋白缺乏症和低丙种球蛋白血症的替代治疗，也可用于治疗先天血小板减少性紫癜、川崎病、预防骨髓移植后感染、HIV 感染患儿再发细菌性感染，通过血浆交换用于吉兰－巴雷综合征的治疗。同源人类抗体／免疫球蛋白也可以通过肌内注射或皮下注射途径作为替代治疗，但是静脉注射途径更为常用。

①甲肝。甲肝疫苗用于易感者的免疫保护，包括用于甲肝高流行地区（除北欧、西欧、北美、日本、澳大利亚、新西兰的其他地区）旅行者的免疫预防。随着卫生条件的提高，肌内注射普通免疫球蛋白不再推荐作为国际旅行者的常规保护措施，但是对于免疫功能异常的个体，如果接种甲肝疫苗后不能产生足够的抗体的话，仍需注射免疫球蛋白。

②麻疹。肌内注射免疫球蛋白可以保护或者削弱麻疹对免疫不足个体的威胁。免疫功能低下的儿童和成人暴露于麻疹病毒后应尽快接种免疫球蛋白，72 小时内注射最有效，6 日以内注射有效。对于个体而言，在麻疹暴露之前 3 周内，以 100 mg/kg 的剂量静脉注射免疫球蛋白可以预防个体麻疹感染。如果下列个体曾经接触过麻疹确诊病例或者可疑病例，应该考虑肌内注射免疫球蛋白：非免疫妊娠期

妇女、9月龄以下儿童。

③风疹。肌内注射免疫球蛋白不能保护非免疫个体的风疹暴露，不推荐用于妊娠期妇女的免疫保护。使用免疫球蛋白可以减少临床发作的可能性，从而减少对胎儿的风险，因此如果妊娠期妇女不愿终止妊娠，则应在暴露之后尽早注射免疫球蛋白。

(2) 注意事项：同源人类抗体／免疫球蛋白不能用于含有对免疫球蛋白A抗体的患者。静脉用同源人类抗体／免疫球蛋白很少诱发血栓栓塞，但肥胖个体和具有发生动静脉血栓的个体应该谨慎使用。同源人类抗体／免疫球蛋白可能影响活病毒疫苗的免疫应答，所以在其使用前至少3周或者使用后至少3个月接种活病毒疫苗。(不包括黄热病疫苗，因为普通免疫球蛋白不包括针对此病毒的抗体)，更多注意事项详见产品说明。

(3) 不良反应：使用同源人类抗体／免疫球蛋白的不良反应包括机体不适、寒战、发热和过敏反应（极少发生）。

18.3.1.2 同源人类高效价免疫球蛋白

同源人类高效价免疫球蛋白是一种含有高滴度的特异性抗体的制品，由含有高水平抗体的捐献者血清制备。但是，由于高效价免疫球蛋白来自人体，它也含有少量其他抗体。高效价免疫球蛋白被用于一些疾病暴露后的预防，包括乙肝、狂犬病、破伤风和水痘。

(1) 乙肝：虽然现在乙肝疫苗用于高危人群的免疫保护，但是在下列情况下应该使用乙肝疫苗和乙肝免疫球蛋白联合免疫，如意外（经皮肤、黏膜）暴露、乙肝表面抗原阳性的个体有性暴露以及婴儿在围产期暴露。暴露后尽早肌内注射乙肝免疫球蛋白，成人和10岁以上的儿童使用500 U，＜5岁的儿童使用200 U，5～9岁的儿童使用300 U；新生儿应在出生后尽早接种200 U。

(2) 狂犬病：未免疫个体暴露于从高危地区或来自于高危地区的动物，应该立即用肥皂水清洗伤口并使用抗狂犬病免疫球蛋白，大部分剂量浸润注射在伤口周围，余下的剂量一次性肌内注射（同侧大腿，头部咬伤可注射于颈背部肌肉）。同时接种狂犬疫苗，20 U/kg浸润注射在洁净伤口周围，如果伤口不明显或伤口已经愈合，可以在同侧大腿肌内注射（远离疫苗接种部位）。

(3) 破伤风：①有可能感染破伤风伤口的处理。及早彻底清创，使用抗破伤风免疫球蛋白、适当使用抗生素和含有破伤风的疫苗。对于确定的破伤风感染，彻底清创。联合使用抗破伤风免疫球蛋白和甲硝唑。肌内注射抗破伤风免疫球蛋白。②预防性使用，肌内注射250 U，如果感染后超过24小时或者新生儿破伤风严重感染可增加剂量至500 U。治疗性使用，150 U/kg（多部位）。

18.3.1.3 其他免疫球蛋白

人免疫球蛋白[保(乙)]

Human Immunoglobulin

【适应证】主要用于预防麻疹和传染性肝炎。若与抗生素合并使用，可提高对某些严重细菌和病毒感染的疗效。

【注意事项】(1) 本品出现浑浊，有摇不散的沉淀、异物或玻瓶有裂纹、过期失效、均不可使用。(2) 开瓶后应一次注射完毕，不得分次使用。(3) 运输及贮存过程中严禁冻结。

【禁忌证】(1) 对免疫球蛋白过敏或有其他严重过敏史者。(2) 有IgA抗体的选择性IgA缺乏者。

【用法与用量】(1) 用法：只限于肌内注射，不得用于静脉输注。(2) 剂量：①预防麻疹，为预防发病或减轻症状，可在与麻疹患者接触7日内按体重注射0.05～0.15 ml/kg，5岁以下儿童注射1.5～3.0 ml，6岁以上儿童最大注射量不超过6 ml。一次注射预防效果通常为2～4周。②预防传染性肝炎，按体重注射0.05～0.1 ml/kg，或成人一次注射3 ml，儿童一次注射1.5～3 ml，一次注射预防效果通常为1个月左右。另有冻干人免疫球蛋白（Lyophilized Human Immunoglobulin）。

静脉注射用人免疫球蛋白(pH4)［保（乙）］

Lyophilized Human Immunoglobulin (pH4)

【适应证】(1) 原发性免疫球蛋白缺乏症，如X连锁低免疫球蛋白血症、常见变异性免疫缺陷病、免疫球蛋白G亚型缺陷病等；继发性免疫球蛋白缺陷病，如重症感染、新生儿败血症等；自身免疫性疾病，如原发性血小板减少性紫癜、川崎病。(2) 用于预防麻疹。(3) 用于防治传染性肝炎、麻疹、水痘、腮腺炎、带状疱疹、风疹等病毒性感染和细菌性感染（如慢性淋巴细胞白血病患者预防感染）。(4) 用于哮喘、过敏性鼻炎、湿疹等内源性过敏性疾病。

【注意事项】(1) 本品专供静脉输注用。(2) 如需要，可以用5%葡萄糖溶液稀释本品，但糖尿病患者应慎用。(3) 药液呈现混浊、沉淀、异物或瓶子有裂纹、过期失效，不得使用。(4) 本品开启后，应一次输注完毕，不得分次或给第二人输用。(5) 有严重酸碱代谢紊乱的患者应慎用。(6) 对孕妇或可能妊娠妇女的用药应慎重，如有必要应用时，应在医师指导和严密观察下使用。

【禁忌证】(1) 对本品过敏或有其他严重过敏史者。(2) 有抗IgA抗体的选择性IgA缺乏者。

【不良反应】(1) 极个别患者在输注时出现一过性头痛、心慌、恶心等不良反应，可能与输注速度过快或个体差异有关。上述反应大多轻微且常发生在输液开始1小时内，因此建议在输注的全过程定期观察患者的一般情况和生命特征，必要时减慢或暂停输注，一般无需特殊处理即可自行恢复。个别患者可在输注结束后发生上述反应，一般在24小时内均可自行恢复。(2) 偶见变态反应（如荨麻疹、喉头水肿），严重者可见过敏性休克。(3) 大剂量或给药速度过快时，可见头痛、心悸、恶心和暂时性体温升高。

【用法与用量】用法：冻干制剂采用严格的无菌操作，按规定量加入灭菌注射用水，轻轻旋摇（避免出现大量泡沫）使完全溶解。以5%葡萄糖溶液稀释作静脉滴注 ，开始滴注速度为每分钟1.0 ml持续15分钟后若无不良反应，可逐渐加快速度，最快滴注速度不得超过每分钟3.0 ml。用量：遵医嘱。推荐剂量：①原发性免疫球蛋白缺乏或低下症：首次剂量400 mg/kg，维持剂量200～400 mg/kg，给药间隔时间视患者血清IgG水平和病情而定，一般每月1次。②原发性血小板减少性紫癜：一日400 mg/kg，连续5日，维持剂量一次400 mg/kg，间隔时间视血小板计数和病情而定，一般每周1次。③重症感染：每日200～300 mg/kg，连续2～3日。④川崎病：发病10日内应用，儿童治疗剂量2.0 g/kg，一次输注。

【制剂与规格】冻干静脉注射用人免疫球蛋白(pH4)：①1 g；②1.25 g；③2.5 g；④4 g。

人乙型肝炎免疫球蛋白

Human Hepatitis B Immunoglobulin

【适应证】主要用于乙型肝炎预防。(1) 乙型肝炎表面抗原(HBsAg)阳性的母亲及所生的婴儿。(2) 意外感染的人群。(3) 与乙型肝炎患者和乙型肝炎病毒携带者密切接触者。

【注意事项】(1) 本品应为无色或淡黄色可带乳光澄清液体。久存可能出现微量沉淀，但一经摇动应立即消散，如有摇不散的沉淀或异物不得使用。(2) 安瓿破裂、过期失效者不得使用。(3) 本品开启后，应一次输注完毕，不得分次使用或给第二个人使用。

【禁忌证】(1) 对人免疫球蛋白过敏或有其他严重过敏史者。(2) 有IgA抗体的选择性IgA缺乏者。

【用法与用量】(1) 用法：本品只限肌内注射，不得用于静脉输注。(2) 剂量：①母婴阻断。HBsAg阳性的孕妇从产前3个月起每月注射1次，每次剂量200～400 U。HBsAg阳性母亲所生婴儿出生24小时内注射本品100 U；注射乙型肝炎疫苗的剂量及时间见乙型肝炎疫苗说明书或按医生推荐的其他适宜方案。②乙型肝炎预防。一次注射量儿童为100 U，成人

为200 U，必要时可间隔3～4周再注射一次。③意外感染者，立即（最迟不超过7日）按体重注射8～10 U/kg，隔月再注射1次。

人狂犬病免疫球蛋白[保(乙)]

Human Rabies Immunoglobulin

【适应证】主要用于被狂犬或其他疯动物咬伤、抓伤患者的被动免疫。

【注意事项】(1) 本品不得用作静脉注射。(2) 本品肌内注射不需做皮肤敏感试验。(3) 如有异物或摇不散的沉淀，安瓿出现裂纹或过期失效等情况，不得使用。

【禁忌证】对人免疫球蛋白过敏或有其他严重过敏史者。

【用法与用量】(1) 用法：及时彻底清创后，于受伤部位用本品总剂量的1/2做皮下浸润注射，余下1/2进行肌内注射（头部咬伤者可注射于背部肌肉）。(2) 剂量：注射剂量按体重20 U/kg计算（或遵医嘱），一次注射，如所需总剂量＞10 ml，可在1～2日分次注射。随后即可进行狂犬病疫苗注射，但两种制品的注射部位和器具要严格分开。另有制剂冻干人狂犬病免疫球蛋白（Lyophilized Human Rabies Immunoglobulin）。

人破伤风免疫球蛋白[保(乙)]

Human Tetanus Immunoglobulin

【适应证】主要用于预防和治疗破伤风，尤其适用于对破伤风抗毒素（TAT）有过敏反应者。

【注意事项】(1) 应用本品做被动免疫的同时，可使用吸附破伤风疫苗进行自动免疫，但注射部位和用具应分开。(2) 制品应为澄清或可带乳光液体，可能出现微量沉淀，但一经摇动应立即消散。若有摇不散的沉淀或异物，以及安瓿有裂纹、过期失效等情况，均不得使用。(3) 开瓶后，制品应一次注射完毕，不得分次使用。

【禁忌证】对人免疫球蛋白类制品有过敏史者禁用。

【用法与用量】(1) 用法：供臀部肌内注射，不需做皮试，不得用作静脉注射。(2) 剂量：①预防剂量，儿童、成人一次用量250 U，创面严重或创面污染严重者可加倍。②参考治疗剂量，3 000～6 000 U，尽快用完，可多点注射。另有制剂冻干人破伤风免疫球蛋白（Lyophilized Human Tetanus Immunoglobulin）。

18.3.2 抗血清

异体高价免疫血清也被称为抗毒素，这种产品在动物（通常是马或马科动物）体内产生，包含的抗体只针对某一种抗原。这种产品存在的问题是血清病，一种对马蛋白的免疫反应（过敏反应）。因为其经常伴随高敏反应，所以同源人类免疫球蛋白已经代替了异体免疫血清（抗毒素）。

白喉抗毒素[保(甲)]

Diphtheria Antitoxin

【适应证】用于预防和治疗白喉。对已出现白喉症状者应及早注射抗毒素治疗。未经白喉类毒素免疫注射或免疫史不清者，如与白喉患者有密切接触，可注射抗毒素进行紧急预防，但也应同时进行白喉类毒素预防注射，以获得持久免疫。

【注意事项】(1) 本品为液体制品。制品浑浊、有摇不散的沉淀、异物或安瓿有裂纹、标签不清者均不能使用。安瓿打开后应一次用完。(2) 每次注射须保存详细记录，包括姓名、性别、年龄、住址、注射次数、上次注射后的反应情况、本次过敏试验结果及注射后反应情况、所用抗毒素的生产单位名称及批号等。(3) 注射用具及注射部位应严格消毒。注射器宜专用，如不能专用，用后应彻底洗净处理，最好干烤或高压蒸汽灭菌。同时注射类毒素时，注射器须分开。(4) 使用抗毒素须特别注意防止过敏反应。注射前必须先做过敏试验并详细询问既往过敏史。凡本人及其直系亲属曾有支气管哮喘、花粉病、湿疹或血管神经性水肿等病史，或对某种物质过敏，或本人过去曾注射马血清制剂者，均须特别提防过敏反应的发生。①过敏试验：用氯化钠注射液将抗毒素稀释10倍（0.1 ml抗毒素加0.9 ml氯化钠注射液），在前臂掌侧皮内注射0.05 ml，观察30分钟。注射部位无明显反应者，即为阴性，可在严密观察下直接注射抗毒素。如注射部位出现皮丘增大、红肿、浸

润，特别是形似伪足或有痒感者，为阳性反应，必须用脱敏法进行注射。如注射局部反应特别严重或伴有全身症状，如荨麻疹、鼻咽刺痒、喷嚏等，则为强阳性反应，应避免使用抗毒素。如必须使用时，则应采用脱敏注射，并做好抢救准备，一旦发生过敏休克，立即抢救。无过敏史者或过敏反应阴性者，也并非没有发生过敏休克的可能。为慎重起见，可先注射小量于皮下进行试验，观察 30 分钟，无异常反应，再将全量注射于皮下或肌内。②脱敏注射法：在一般情况下，可用氯化钠注射液将抗毒素稀释 10 倍，分小量数次做皮下注射，一次注射后观察 30 分钟。第 1 次可注射 10 倍稀释的抗毒素 0.2 ml，观察无发绀、气喘或显著呼吸短促、脉搏加速时，即可注射第 2 次 0.4 ml，如仍无反应则可注射第 3 次 0.8 ml，如仍无反应即可将安瓿中未稀释的抗毒素全量做皮下或肌内注射。有过敏史或过敏试验强阳性者，应将第 1 次注射量和以后的递增量适当减少，分多次注射，以免发生剧烈反应。(5) 门诊患者注射抗毒素后，须观察 30 分钟始可离开。

【禁忌证】过敏试验为阳性反应者慎用（详见脱敏注射法）。

【用法与用量】(1) 用法：皮下注射应在上臂三角肌附着处。同时注射类毒素时，注射部位须分开。肌内注射应在上臂三角肌中部或臀大肌外上部。只有经过皮下或肌内注射未发生反应者方可做静脉注射。静脉注射应缓慢，开始每分钟不超过 1 ml，以后每分钟不宜超过 4 ml。一次静脉注射不应超过 40 ml，儿童按体重不应超过 0.8 ml/kg，亦可将抗毒素加入葡萄糖注射液、氯化钠注射液等液体中静脉滴注。静脉注射前将安瓿在温水中加热至接近体温，注射中发生异常反应，应立即停止。(2) 剂量：①预防。一次皮下或肌内注射 1 000 ~ 2 000 U。②治疗。表 18-5 可作参考，应力争早期大量注射。另有制剂冻干白喉抗毒素（Diphtheria Antitoxin, Freeze-dried）。

破伤风抗毒素[基(基)，保(甲)]

Tetanus Antitoxin

【适应证】用于预防和治疗破伤风。已出现破伤风或其可疑症状时，应在进行外科处理及其他疗法的同时，及时使用抗毒素治疗。开放性外伤（特别是创口深、污染严重者）有感染破伤风的危险时，应及时进行预防。凡已接受过破伤风类毒素免疫注射者，应在受伤后再注射 1 针类毒素加强免疫，不必注射抗毒素；未接受过类毒素免疫或免疫史不清者，须注射抗毒素预防，但也应同时开始类毒素预防注射，以获得持久免疫。

【注意事项】见白喉抗毒素。

【禁忌证】过敏试验为阳性反应者慎用，详见白喉抗毒素脱敏注射法。

【用法与用量】(1) 用法：见白喉抗毒素。(2) 剂量：①预防。一次皮下或肌内注射 1 500 ~ 3 000 U，儿童与成人用量相同；伤势严重者可增加用量 1 ~ 2 倍。经 5 ~ 6 日，如破伤风感染危险未消除，应重复注射。②治疗：第 1 次肌内或静脉注射 50 000 ~ 200 000 U，儿童与成人用量相同；以后视病情决定注射剂量与间隔时间，同时还可以将适量的抗毒素注射于伤口周围的组织中。初生儿破伤风，

表 18-5　白喉抗毒素的用法与用量

假膜所侵范围	注射与发病相距时间(小时)	应注射抗毒素剂量 (U)	假膜所侵范围	注射与发病相距时间(小时)	应注射抗毒素剂量 (U)
一边扁桃体	24	8 000	两边扁桃体、悬雍垂、鼻咽或喉部	24	24 000
	48	16 000		48	48 000
	72	32 000		72	72 000
两边扁桃体	24	16 000	白喉病变（仅限于鼻部）		8 000~16 000
	48	32 000			
	72	48 000			

24 小时内分次肌内或静脉注射 20 000 ~ 100 000 U。另有制剂冻干破伤风抗毒素(Lyophilized Tetanus Antitoxin)。

肉毒抗毒素[保(甲)]

Botulinum Antitoxin

【适应证】用于预防及治疗肉毒中毒。凡已出现肉毒中毒症状者，应尽快使用本抗毒素进行治疗。对可疑中毒者亦应尽早使用本抗毒素进行预防。在一般情况下，人的肉毒中毒多为 A 型、B 型、或 E 型，中毒的毒素型别尚未得到确定之前，可同时使用 2 个型，甚至 3 个型的抗毒素。

【注意事项】见白喉抗毒素。

【禁忌证】过敏试验为阳性反应者慎用，详见白喉抗毒素脱敏注射法。

【用法与用量】(1) 用法：见白喉抗毒素。(2) 剂量：①预防。一次皮下注射或肌内注射 1 000 ~ 20 000 U(指 1 个型)。若情况紧急，亦可酌情增量或采用静脉注射。②治疗。采用肌内注射或静脉滴注。第 1 次注射 10 000 ~ 20 000 U（指 1 个型)，以后视病情决定，可每隔约 12 小时注射 1 次。只要病情开始好转或停止发展，即可酌情减量（例如减半）或延长间隔时间。另有制剂冻干肉毒抗毒素(Lyophilized Botulinum Antitoxin)。

抗蛇毒血清[基(基), 保(甲)]

Snake Antivenins

【适应证】用于蛇咬伤者的治疗，其中蝮蛇毒血清，对竹叶青蛇和烙铁头蛇咬伤亦有疗效。咬伤后，应迅速注射本品，愈早愈好。

【注意事项】(1) 本品为液体制品。制品浑浊、有摇不散的沉淀、异物或安瓿有裂纹、标签不清者均不能使用。安瓿打开后应一次用完。(2) 每次注射须保存详细记录，包括姓名、性别、年龄、住址、注射次数、上次注射后的反应情况、本次过敏试验结果及注射后反应情况、所用抗血清的生产单位名称及批号等。(3) 注射用具及注射部位应严格消毒。注射器宜专用，如不能专用，用后应彻底洗净处理，最好干烤或高压蒸汽灭菌。同时注射类毒素时，注射器须分开。(4) 使用抗血清须特别注意防止过敏反应。注射前必须先做过敏试验并详细询问既往过敏史。凡本人及其直系亲属曾有支气管哮喘、花粉病、湿疹或血管神经性水肿等病史，或对某种物质过敏，或本人过去曾注射马血清制剂者，均须特别提防过敏反应的发生。遇有血清过敏反应，用抗过敏治疗。即肌内注射氯苯那敏。必要时，应用地塞米松 5 mg 加入 25%（或 50%）葡萄糖注射液 20 ml 中静脉注射或氢化可的松琥珀酸钠 135 mg 或氢化可的松 100 mg 加入 25%（或 50%）葡萄糖注射液 40 ml 中静脉注射，亦可静脉滴注。(5) 对蛇咬伤者，应同时注射破伤风抗毒素 1 500 ~ 3 000 U。(6) 门诊患者注射抗血清后，需观察至少 30 分钟方可离开。

【禁忌证】过敏试验为阳性反应者慎用。

【用法与用量】(1) 用法：通常采用静脉注射，也可做肌内或皮下注射，一次完成。(2) 剂量：一般蝮蛇咬伤注射抗蝮蛇毒血清 6 000 U；五步蛇咬伤注射抗五步蛇毒血清 8 000 U；银环蛇或眼镜蛇咬伤注射抗银环蛇毒血清 10 000 U 或抗眼镜蛇毒血清 2 000 U。以上剂量约可中和一条相应蛇的排毒量。视病情可酌情增减。(3) 注射前必须做过敏试验，阴性者才可全量注射。① 过敏试验方法：取 0.1 ml 抗血清加 1.9 ml 生理氯化钠注射液，即 20 倍稀释。在前臂掌侧皮内注射 0.1 ml，经 20 ~ 30 分钟，注射皮丘在 2 cm 以内，且皮丘周围无红晕及蜘蛛足者为阴性，可在严密观察下直接注射。若注射部位出现皮丘增大、红肿、浸润，特别是形似伪足或有痒感者，为阳性反应。若阳性可疑者，预先注射氯苯那敏 10 mg（儿童根据体重酌减），15 分钟后再注射本品，若阳性者应采用脱敏注射法。②脱敏注射法：取氯化钠注射液将抗血清稀释 20 倍。分数次做皮下注射，一次观察 10 ~ 20 分钟，第 1 次注射 0.4 ml。如无反应，可酌情增量注射。注射观察 3 次以上，无异常反应者，即可做静脉、肌内或皮下注射。注射前将制品在 37℃ 水浴加温数分钟。注射时速度应慢，开始每分钟不超过 1 ml 以后亦不宜超过 4 ml。注射时，如有异常反应，

应立即停止注射。

多价气性坏疽抗毒素[保(甲)]

Gas-gangrene Antitoxin (Mixed)

【适应证】用于预防及治疗气性坏疽。当受严重外伤，认为有发生气性坏疽的危险或不能及时施行外科处置时，应及时注射本品预防。一旦病症出现，除及时采取其他措施外，要尽快使用大量抗毒素进行治疗。

【注意事项】(1) 本品为冻干制品。应按标签上规定的量加入灭菌注射用水，轻摇使完全溶解。如有摇不散的沉淀、异物或安瓿有裂纹、标签不清、过期失效者均不能使用。安瓿打开后应一次用完。(2) 每次注射须保存详细记录，包括姓名、性别、年龄、住址、注射次数、上次注射后的反应情况、本次过敏试验结果及注射后反应情况、所用抗毒素的生产单位名称及批号等。(3) 注射用具及注射部位应严格消毒。注射器宜专用，如不能专用，用后应彻底洗净处理，最好干烤或高压蒸汽灭菌。同时注射类毒素时，注射器须分开。(4) 使用抗毒素须特别注意防止过敏反应。注射前必须做过敏试验并详细询问既往过敏史。凡本人及其直系亲属曾有支气管哮喘、花粉症、湿疹或血管神经性水肿等病史，或对某种物质过敏，或本人过去曾注射马血清制剂者，均须特别提防过敏反应的发生。(5) 过敏试验为阳性反应者慎用，详见脱敏注射法。

【不良反应】(1) 过敏休克：可在注射中或注射后数分钟至数十分钟内突然发生，患者突然表现沉郁或烦躁、脸色苍白或潮红、胸闷或气喘、出冷汗、恶心或腹痛、脉搏细速、血压下降、重者神志不清虚脱，如不及时抢救可以迅速死亡。轻者注射肾上腺素后即可缓解；重者需输液输氧，使用升压药维持血压，并使用抗过敏药物及肾上腺皮质激素等进行抢救。(2) 血清病：主要症状为荨麻疹、发热、淋巴结肿大、局部水肿，偶有蛋白尿、呕吐、关节痛，注射部位可出现红斑、瘙痒及水肿。一般在注射后 7 ~ 14 日发病，称为延缓型；亦有在注射后 2 ~ 4 日发病，称为加速型。对血清病应对症疗法，可使用钙剂或抗组胺药物，一般数日至十数日即可痊愈。

【用法与用量】(1) 用法：皮下注射应在上臂三角肌附着处．同时注射类毒素时，注射部位须分开。肌内注射应在上臂三角肌中部或臀大肌外上部。只有经过皮下或肌内注射未发生异常反应者方可做静脉注射，静脉注射应缓慢，开始每分钟不超过 1 ml，以后每分钟不宜超过 4 ml。一次静脉注射不应超过 40 ml，儿童按体重不应超过 0.8 ml/kg，亦可将抗毒素加入葡萄糖注射液、氯化钠注射液等输液中静脉滴注。静脉注射前将安瓿在温水中加热至接近体温，注射中发生异常反应，应立即停止。(2) 用量：①预防，一次皮下或肌内注射 1 万 U(混合)左右，在紧急情况下，可酌增用量，亦可采用静脉注射；伤口感染的危险未消除者，可每隔 5 ~ 6 日反复注射 1 次。②治疗：第 1 次注射 3 万 ~ 5 万 U（混合）于静脉内，同时注射适量于伤口周围健康组织内，以后可根据病情，经适当的间隔时间(如 4 ~ 6 或 12 小时)反复注射；病情开始好转后，可酌情减量(例如减半)或延长间隔时间(例如 24 ~ 48 小时)，直到确认无需继续注射为止。

【制剂与规格】冻干多价气性坏疽抗毒素：1 500 U。

抗炭疽血清[保(甲/乙)]

Anthrax Antiserum

【适应证】本药用于炭疽病人的治疗及有炭疽感染危险者的预防。

【注意事项】(1) 开瓶后应一次用完。(2) 注射前须详细询问既往过敏史，凡曾有支气管哮喘、花粉症、湿疹或血管神经性水肿等病史，或有过敏史，或曾注射过马血清制剂者，均应注意变态反应的发生。(3) 病人注射血清后，至少须观察 30 分钟方可离开。

【不良反应】(1) 过敏性休克：可在注射中或注射后数分钟至数十分钟内突然发生。患者突然表现抑郁或烦躁、面色苍白或潮红、胸闷或气喘、出冷汗、恶心或腹痛、脉搏细速、血压下降，重者神智昏迷或虚脱，如不及时抢救可迅速死亡。

(2) 血清病：主要表现为荨麻疹、发热及淋巴结肿大、局部水肿。偶有蛋白尿、呕吐、关节痛及注射部位出现红斑、瘙痒及水肿。一般是在注射后 7 ~ 14 日发病，称为延缓型。亦有在注射后 2 ~ 4 日发病，称为加速型。

【用法与用量】(1) 预防用：皮下或肌内注射，一次 20 ml。(2) 治疗用：根据病情肌内注射或静脉滴注。早期应给予大剂量，第 1 日注射 20 ~ 30 ml。待体温恢复正常，水肿消退后，可根据病情给予维持量。

【制剂与规格】精制抗炭疽血清注射液：① 5 ml；② 20 ml。

精制抗狂犬病血清[保（乙）]

Purified Rabies Antiserum

【适应证】用于治疗发疯动物咬伤。

【注意事项】同抗炭疽血清。

【不良反应】(1) 过敏性休克：可在注射中或注射后数分钟至数十分钟内突然发生。患者突然表现抑郁或烦躁、面色苍白或潮红、胸闷或气喘、出冷汗、恶心或腹痛、脉搏细速、血压下降，重者神志昏迷或虚脱，如不及时抢救则迅速死亡。(2) 血清病：主要为荨麻疹、发热及淋巴结肿大、局部水肿，偶有蛋白尿、呕吐、关节痛，注射部位可出现红斑、瘙痒及水肿。一般在注射后 7 ~ 14 日发病，称为延缓型。亦有在注射后 2 ~ 4 日发病，称为加速型。

【用法与用量】肌内注射：成人注射量均按体重 40 U/kg(特别严重者可酌情增量至 80 ~ 100 U)，在 1 ~ 2 日内分数次注射，注射完毕后开始注射狂犬病疫苗。亦可同时注射狂犬病疫苗，但两者的注射部位必须分开。

【制剂与规格】精制抗狂犬病血清注射液：① 200 U；② 400 U；③ 700 U；④ 1 000 U。

18.4 国际旅行

前往脊髓灰质炎或者结核病高发现场的旅行者需要进行免疫，已接种过脊髓灰质炎疫苗的成人需要灭活疫苗加强免疫，35 岁以下的旅行者如果计划在结核病发病率超过 40/10 万的地区停留时间超过 1 个月，或者和当地人近距离接触，则推荐接种卡介苗，最好在启程前 3 个月或更早的时间接种。

黄热病疫苗推荐去往非洲和南美洲流行地域的旅行者使用，许多国家需要来自这些区域的人们或者曾在这些区域旅行的个体出示疫苗接种证明，与此同时，进入这些区域的旅行者也要出示疫苗接种证明。

狂犬疫苗推荐前往地方性动物疾病地区长期旅行或者旅行目的地难以得到快捷的医疗服务的旅行者使用。

最近 10 年没有加强接种破伤风疫苗的旅行者或者旅行地不易得到医疗服务的旅行者，应该加强接种吸附白喉(低剂量)、破伤风和灭活脊髓灰质炎疫苗，即使以前接种过 5 次含破伤风的疫苗。

伤寒疫苗用于前往伤寒流行地区的旅行者，除了疫苗没有其他可以代替的防护措施。

旅行者没有必要接种霍乱疫苗，但是自助旅行者和前往危险性极高的地区（如难民营）应该考虑使用口服霍乱疫苗。无论是否接种霍乱疫苗，旅行者到霍乱流行地区都要特别注意食品卫生。

流脑疫苗接种也在世界的一些区域推荐使用。

第19章 急性中毒救治用药

19.1 概 述

毒物大量进入体内，对机体造成严重损伤，引起功能障碍甚至死亡，应及时采取救治措施，对挽救生命、减轻损伤至关重要。急性中毒治疗原则主要包括：①终止接触毒物及清除毒物；②促进已吸收毒物的排泄；③使用特效解毒剂；④对症治疗。

19.1.1 清除毒物

经口中毒者，在有效的时间内进行催吐、洗胃和导泻。催吐只有在气道通畅的情况下才能进行，简单易行的方法是刺激咽后壁或舌根部诱发呕吐，也可用催吐药物，如口服0.2%～1%硫酸锌溶液50～200 ml或1%硫酸铜溶液25～50 ml；必要时皮下注射阿扑吗啡。

神志不清或不合作者可用洗胃法，洗胃应尽早进行，一般在服毒后6小时内最有效，如果摄取腐蚀性物质或石油馏分时，不能催吐和洗胃。洗胃液应根据毒物的性质选用，常用的有2%～4%碳酸氢钠溶液、0.01%～0.02%高锰酸钾溶液、1%硫代硫酸钠溶液、0.9%氯化钠溶液及温清水。在毒物不明的情况下，一般采用0.45%～0.9%氯化钠溶液或温清水洗胃。洗胃后，根据需要可服用50～100 g药用炭混悬液吸附毒物，而且越早越好。

灌肠导泻也是为了减少毒物的吸收，尤其适用于服用缓释或肠溶衣制剂的中毒。导泻一般口服或胃管导入50%硫酸钠溶液或50%硫酸镁溶液50 ml。

为加速毒物排泄，根据情况可做血液透析。

19.1.2 对症治疗

(1) 呼吸：呼吸减弱或呼吸困难者，要防止呼吸道阻塞，使呼吸道保持通畅。吸氧，必要时行气管插管或气管切开，呼吸兴奋剂应避免使用。巴比妥类、苯二氮䓬类中毒引起呼吸抑制，可用纳洛酮0.4～0.8 mg静脉注射，必要时可重复使用。

(2) 血压：重度中毒时常出现低血压，收缩压小于70 mmHg可能导致不可逆转的脑损伤或肾小管坏死。首先将患者头部放低，要补充血容量（先晶体后胶体），如果血压仍不能纠正，给予血管活性药，首选多巴胺。

(3) 心脏：心脏传导阻滞和心律失常发生在急性中毒时，三环抗抑郁药、抗精神病药、抗组胺药容易引起，需纠正低氧血症、酸中毒和其他原因引起的心律失常。心电图QT间隔延长时给予钙剂。室性早搏按常规静脉注射利多卡因。尖端扭转型室性心动过速、血流动力学不稳定的患者实施心脏调搏或电转复。如果出现心力衰竭，静脉注射强心苷类药物。

(4) 体温：出现低温或高温都要及时处理。较长时间深度昏迷者，尤其是巴比妥类药物和氯噻嗪类药物过量可能出现低温症状，注意保温即可。服用中枢神经系统兴奋药的患者可能出现高温症状；服用治疗剂量的抗毒蕈碱药物时，儿童和老年人也是有风险的，出现高热，以物理降温为主，酒精或温水擦浴，但不能用冰水；

也可用亚冬眠疗法降温，冬眠疗法药物有利于防止抽搐。

（5）惊厥：单一短暂的惊厥不需要处理，如果惊厥延长或经常发作，应及时采取措施，若抽搐时间过长，会造成缺氧性脑损伤，可采用劳拉西泮 4 mg 或地西泮 10 mg 缓慢静脉注射，用于惊厥，苯二氮䓬类不应该肌内注射；也可用异戊巴比妥钠 0.1 ~ 0.3 g 缓慢静脉注射，或苯巴比妥钠 0.2 ~ 0.4 g 肌内注射，或 10%葡萄糖酸钙 10 ml 稀释后静脉注射，一日 4 ~ 6 次，抽搐停止后尚应减少剂量应用，防止再发。

（6）脑水肿、肺水肿：地塞米松 10 ~ 20 mg 静脉注射，一日 2 ~ 3 次，20%甘露醇 250 ml 快速静脉滴注，一日 2 ~ 3 次，连用 2 ~ 3 天。肺水肿消退前，限制进入液体量，必须补液时，应严格控制输液量和滴速。使用排钾利尿药注意补钾。

19.2 解毒药

解毒药系指能排除或中和毒物，拮抗毒性作用，减弱毒性反应，解除或减轻中毒症状，降低中毒死亡，以治疗中毒为目的的药物。

根据药物作用机制，解毒药可分为非特异性解毒药和特异性解毒药两大类。

（1）非特异性解毒药：非特异性解毒药是一类通过阻止毒物吸收、促进毒物排泄发挥解毒作用的药物，又称为通用解毒药。非特异性解毒药可用于各种毒物的中毒，但无针对性解毒作用，多用作辅助治疗。非特异性解毒药包括物理性解毒药、化学性解毒药等，如吸附剂活性炭、沉淀剂鞣酸、中和剂醋酸和氧化剂高锰酸钾等。

（2）特异性解毒药：特异性解毒药是一类具有高度专属性的对特定毒物有解毒作用的药物，又称为特效解毒药。特异性解毒药主要有金属络合剂、胆碱酯酶复活剂、高铁血红蛋白形成剂等；其他还有亚硝酸盐中毒解毒药亚甲蓝、阿片类药物中毒解毒药纳洛酮与烯丙吗啡、肼类化合物中毒解毒药维生素 B_6、抗凝血类灭鼠剂解毒药维生素 K_1、苯二氮䓬类药物中毒解毒药氟马西尼、对乙酰氨基酚中毒解毒药乙酰半胱氨酸、有机氟农药中毒解毒药乙酰胺、抗叶酸代谢药过量中毒解毒药亚叶酸钙等。

19.2.1 非特异性解毒药

药用炭 [保(甲)]

Medicinal Charcoal

【适应证】吸附剂，用于食物、生物碱等中毒及腹泻腹胀气等。

【注意事项】（1）意识丧失者慎用。（2）本品用量可根据病情来选择，一般中毒初期即毒物没有完全吸收入血时，可用较大量，一般认为药用炭与被吸附物质的比例以 10 ∶ 1 最合适。若毒物大部分已被吸收入血，本品用量应酌情减量，但要增加服用次数。（3）解毒时药用炭摄入后应随即给一剂泻药，以促进毒物－碳复合物迅速排出，否则仍有中毒的可能。（4）本品与山梨醇或甘露醇同服，可减少因本品引起的小肠阻塞。（5）血液灌流用的活性炭罐装有包膜的活性炭珠，每罐装 200 ~ 250 g，可供灌流 2 小时。

【禁忌证】（1）强酸、强碱等腐蚀性毒物禁用。（2）3 岁以下小儿禁用。

【不良反应】口服几无不良反应，长期或大量服用可引起便秘

【用法与用量】口服或灌胃：（1）解毒：成人常用量：30 ~ 100 g，加水 300 ~ 400 ml 搅拌成悬浮液后使用。（2）肠道疾患：一次 1 ~ 3 g，一日 3 ~ 9 g，饭前服。

【制剂与规格】粉状药用炭：500 g。

药用炭片：① 0.3 g；② 0.5 g。

除了吸附剂药用炭外，其他非特异性解毒药包括沉淀剂、中和剂和氧化剂。

（1）沉淀剂：常用的沉淀剂是鞣酸。鞣酸可与部分有机或无机毒物结合成难溶性复合物而形成沉淀。但结合能力弱，易于解离。沉淀作用受 pH 影响，在胃的酸性环境中作用较强，在肠道碱性环境中，其沉淀作用明显减弱。鞣酸能沉淀的毒物包括奎宁、奎尼丁、士的宁、洋地黄、铅、银、铜和锌等。对毒扁豆碱、阿托品、吗啡、可卡因、烟碱、砷、锑、汞等无沉淀作用。鞣酸及其代谢产物对肝脏有损害，故不应留置胃内以免吸收。与活性炭比较，解毒

效果和安全性均不如活性炭，现已主张以活性炭代替鞣酸。常用 2% ~ 4% 鞣酸溶液洗胃或灌入浓茶一大杯。

其他沉淀剂介绍如下：①硫酸钠或硫酸镁用于可溶性钡盐（如氯化钡、硝酸钡）及铅盐口服中毒，可形成不吸收的硫酸盐沉淀。剂量：一次口服 30 ~ 60 g，或以 2% ~ 5% 溶液洗胃。② 0.2% ~ 0.5% 硫酸铜溶液用于黄磷口服中毒或皮肤污染，硫酸铜在黄磷表面形成不溶性磷化铜薄膜，可阻止黄磷的吸收及氧化。③ 15% 乳酸钙溶液或 0.5% 氯化钙溶液用于氟化物及草酸盐中毒，可形成不溶性氟化钙或草酸钙。④等渗氯化钠溶液用于硝酸银中毒，可形成无腐蚀作用的氯化银。⑤碳酸氢钠溶液可使胃内的铁盐形成不易吸收的碳酸亚铁。⑥新配制的氢氧化铁溶液可与砷形成不溶性络合物砷酸铁，用法为每 5 ~ 10 分钟服 5 ml，直至发生呕吐为止。⑦ 0.1% 亚铁氰化钾溶液用于铜盐中毒的洗胃、解毒，使形成不溶性亚铁氰化铜沉淀，用量 600 ml。⑧含钙溶液（如 10% 葡萄糖酸钙）可用于卤水（主要成分为氯化镁）中毒的洗胃。⑨氢氧化钙溶液（石灰水）可用于阿片类中毒。⑩误服碘中毒可用淀粉溶液洗胃，至洗出液不变色为止。

（2）中和剂：中和剂系指在摄入强酸性或强碱性毒物时，采用对机体无害的弱碱性或弱酸性物质与其起中和作用，达到降低毒物毒性及防止毒物对胃肠道黏膜的直接损伤的目的。

口服强酸时，其中和剂为弱碱性溶液，如氢氧化铝凝胶 40 ~ 60 ml、氧化镁乳 40 ~ 60 ml。忌用碳酸氢钠，以免形成大量二氧化碳气体引起胃扩张，导致胃穿孔。

口服强碱时，中和剂为弱酸性溶液，如 1% ~ 5% 醋酸、淡醋或橘子汁等。

（3）氧化剂：氧化剂用于洗胃，将毒物氧化而起解毒作用。常用的氧化剂为高锰酸钾，与有机物相遇即释放氧而将有机物氧化，本身还原为二氧化锰，后者可与蛋白结合成蛋白盐类的复合物而起收敛作用。此外，由于呈紫红色的高锰酸钾溶液还原为二氧化锰溶液后，呈淡黄色或无色，观察高锰酸钾洗胃液是否变色可作为洗胃是否彻底的标志。

高锰酸钾对巴比妥类、水化氯醛、吗啡、可待因、士的宁、奎宁、毒扁豆碱、印防己毒素、乌头碱等中毒效果较好；对阿托品、可卡因等中毒无效；对硫代磷酸酯类有机磷农药（如对硫磷），因可氧化为毒性更大的磷酸酯类（如对氧磷），故禁用高锰酸钾洗胃。

高锰酸钾洗胃液的浓度以 1 ∶ 5 000 为最好，浓度低时氧化作用减弱，浓度高则刺激性增大，可腐蚀胃黏膜。

除了常用的氧化剂高锰酸钾外，过氧化氢溶液（3% 过氧化氢 10 ml，加水 100 ml）亦被用于有机物（如生物碱、阿片、士的宁）、高锰酸钾及黄磷等中毒。由于过氧化氢对胃黏膜刺激，并可引起胀气，故一般不用。

19.2.2 特异性解毒药

19.2.2.1 金属、类金属中毒解毒药

金属、类金属中毒解毒剂，实质上是一组金属络合剂，能通过与金属、类金属离子结合而起解毒作用。常用的金属络合剂有以下几类。

（1）氨羧络合剂：如依地酸钙钠、喷替酸钙钠等。

（2）巯基络合剂：如二巯丙醇、二巯丁二钠、二巯丁二酸、二巯丙磺钠、青霉胺等。

（3）羟肟酸络合剂：如去铁胺等。

依地酸钙钠 [保（甲）]

Calcium Disodium Edetate

【适应证】用于铅，亦用于镉、锰、铬、镍、钴和铜等重金属中毒。

【注意事项】（1）对乙二胺过敏者，对本品也可能过敏。（2）各种肾病患者慎用。（3）老年患者慎用，并应减少剂量和疗程。（4）依地酸钙钠注射液直接行肌内注射可引起局部疼痛。为缓解注射引起的疼痛，可用 0.5% 或 1% 盐酸普鲁卡因注射液适量稀释后注射。（5）一日剂量不宜超过 1.5 g，每 1 疗程连续用药不超过 5 日。需要应用第 2 疗程前应停药间歇 4 ~ 7 日。剂量过大和疗程过长不一定成比例地增加尿中金属的排泄量，相反可引起急性肾小管坏死。（6）严重中毒患者不宜应

用较大剂量，否则使血浆中金属络合物大量增加来不及从尿中排出，反而增加对人体的毒性。(7) 儿童急性严重铅脑病一般需采用本品和二巯丙醇联合治疗。具体用药：二巯丙醇按体重一次 4 mg/kg，每 4 ~ 6 小时 1 次，同时应用本品按体重一次 12.5 mg/kg，一日 2 次，疗程 3 ~ 5 日。(8) 每一疗程治疗前后应检查尿常规和肾功能，多疗程治疗过程中要监测血尿素氮、肌酐、钙和磷。

【禁忌证】少尿、无尿或肾功能不全患者禁用。

【不良反应】(1) 头昏、前额痛；食欲缺乏、恶心；畏寒、发热。(2) 组胺样反应，如鼻黏膜充血、喷嚏、流涕和流泪。(3) 可见少数患者有尿频、尿急、蛋白尿、低血压和心电图 T 波倒置。(4) 过大剂量可引起肾小管上皮细胞损害，导致急性肾衰竭，肾脏损害一般在停药后恢复。(5) 有的患者出现高钙血症。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：将本品 1 g，用 5% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 稀释后滴注，滴注时间 4 ~ 8 小时。①成人常用量，一次 1 g，一日 1 次，连续用药 3 日，停药 4 日为 1 疗程；②小儿常用量，按体重一次 25 mg/kg，一日 1 次，连续用药 3 日，停药 4 日为 1 疗程。(2) 肌内注射：将本品 0.5 g，用 1% 盐酸普鲁卡因注射液 2 ml 稀释后作深部肌内注射。成人常用量：一次 0.5 g，一日 1 次，连续用药 3 日，停药 4 日为 1 疗程。

【制剂与规格】依地酸钙钠注射液：5 ml : 1 g。

喷替酸钙钠[保(甲)]

Calcium Trisodium Pentetate

【适应证】(1) 用于铅、铁、锌、钴、铬等重金属中毒。(2) 用于促进钍、铀、钚、钇、锶、镨等放射性核素的排出。

【注意事项】参见依地酸钙钠。

【禁忌证】少尿、无尿或肾功能不全患者禁用。

【不良反应】(1) 可见恶心、呕吐、食欲缺乏、腹泻、头晕、无力、皮肤红斑丘疹等。(2) 大剂量可损害肝、肾功能。

【用法与用量】(1) 静脉滴注：将本品 0.5 ~ 1.0 g，用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 稀释后静脉，滴注时间 4 ~ 8 小时。①成人常用量，一次 0.5 ~ 1.0 g，一日 1 次，连续使用 3 ~ 5 日，间隔 2 ~ 4 日为 1 疗程。②小儿常用量，按体重一次 25 mg/kg，一日 1 次，连续使用 3 ~ 5 日，间隔 2 ~ 4 日为 1 疗程。(2) 肌内注射：将本品 0.5 g，用 1% 盐酸普鲁卡因注射液 2 ml 稀释进行深部肌内注射。①成人常用量，一次 0.5 g，一日 2 次，3 日为 1 疗程；或隔日 1 次，一周 3 次；②小儿常用量，按体重一次 25 mg/kg，一日 2 次，3 日为 1 疗程；或按体重一次 25 mg/kg，隔日 1 次，一周 3 次。

【制剂与规格】喷替酸钙钠注射液：4 ml : 1 g。

注射用喷替酸钙钠：① 0.25 g；② 0.5 g；③ 1.0 g。

二巯丙醇[保(甲)]

Dimercaprol

【适应证】(1) 用于砷中毒和汞、金等重金属中毒。(2) 与依地酸钙钠合用，用于治疗儿童急性铅中毒性脑病。

【注意事项】(1) 老年患者慎用。(2) 心脏病、高血压、肝病、肾脏病和营养不良的患者慎用。(3) 应用本品前后应测量血压和心率。(4) 本品与金属结合的复合物，在酸性条件下容易离解，故应碱化尿液，保护肾脏。(5) 本品给药间隔时间不得少于 4 小时。(6) 本品为灭菌油溶液，肌内注射局部可引起疼痛，并可引起无菌性坏死，因此注射部位须交替进行，并注意局部清洁消毒。(7) 治疗过程中要检查尿常规和肾功能；大剂量长期应用时应定期检查血浆蛋白。

【禁忌证】(1) 对花生或花生制品过敏者禁用。(2) 严重高血压、心力衰竭和肾衰竭的患者禁用。(3) 严重肝功能障碍患者禁用，但砷中毒引起的黄疸除外。(4) 铁、硒、镉中毒患者禁用。(5) 甲基汞和其他有机汞化合物中毒患者禁用，因为应用本品，可使汞进入脑组织。(6) 铁、硒、镉中毒患者禁用，因与这些物质形成的化合物毒性更大。

【不良反应】(1) 常见恶心、呕吐、头痛、唇和口腔灼热感、咽和胸部紧迫感、流泪、流涕、流涎、多汗、腹痛、肢端麻木和异常感觉、肌肉和关节酸痛。(2) 剂量按体重超过 5mg/kg 时，出现心动过速、血压升高、抽搐和昏迷，暂时性血清 ALT 及 AST 增高，持续应用可损伤毛细血管，引起血浆渗出，导致低蛋白血症、代谢性酸中毒、血浆乳酸增高和肾脏损害。(3) 儿童不良反应与成人相同，且可有发热和暂时性中性粒细胞减少。(4) 一般不良反应常在给药后 10 分钟出现，30 ~ 60 分钟后消失。

【用法与用量】(1) 用于砷中毒和汞、金等重金属中毒：肌内注射。①成人常用量，按体重一次 2 ~ 3 mg/kg，第 1、第 2 日每 4 小时 1 次，第 3 日每 6 小时 1 次，第 4 日以后每 12 小时 1 次，疗程一般为 10 日；②小儿常用量：同成人。(2) 儿童急性铅中毒性脑病：肌内注射，按体重一次 4 mg/kg，每 4 ~ 6 小时 1 次，同时应用依地酸钙钠按体重一次 12.5 mg/kg，一日 2 次，疗程 3 ~ 5 日。

【制剂与规格】二巯丙醇注射液：① 1 ml ∶ 100 mg；② 2 ml ∶ 200 mg。

二巯丁二钠[保(甲)]

Sodium Dimercaptosuccinate

【适应证】(1) 用于锑、汞、砷、铅、铜等金属中毒。(2) 用于肝豆状核变性。

【注意事项】(1) 有肝脏疾病者慎用。(2) 本品水溶液呈无色或略带微红色，极不稳定，久置后现混浊或土黄色，则不可使用。(3) 本品不可静脉滴注。(4) 在应用本品前和用药过程中，应根据情况定期检查肝功能，如每 1 ~ 2 周检查 1 次。

【禁忌证】严重肝功能不全者禁用。

【不良反应】(1) 约 50% 的患者在静脉注射后出现轻度头晕，以及头痛、四肢无力、口臭、恶心、腹痛等。(2) 少数患者可见皮疹，皮疹呈红色丘疹，有瘙痒，以面部、颈部、前胸多见；另见咽喉干燥、胸闷、食欲缺乏等。(3) 个别患者有血清 ALT 及 AST 暂时性增高。

【用法与用量】静脉注射。临用时，将本品 1 g 用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 10 ~ 15ml 溶解后供缓慢静脉注射，注射时间 10 ~ 15 分钟。(1) 成人常用量：①急性金属中毒，首次 2 g，以后一次 1 g，一小时 1 次，连续用药 4 ~ 5 次；②亚急性金属中毒：一次 1 g，一日 2 ~ 3 次，连用 3 ~ 5 日；③慢性金属中毒：一次 1 g，一日 1 次，连用 5 ~ 7 日，停药 5 ~ 7 日为一疗程；或一次 1 g，一日 1 次，连用 3 日，停药 4 日为 1 疗程，按病情可用 2 ~ 4 疗程。(2) 小儿常用量：按体重一次 20 mg/kg，用法同成人。

【制剂与规格】注射用二巯丁二钠：① 0.5 g；② 1 g。

二巯丁二酸[保(甲)]

Dimercaptosuccinic Acid

【适应证】(1) 用于铅、汞、砷、锑、铜等金属中毒。(2) 用于肝豆状核变性。

【注意事项】(1) 肝功能不全患者慎用。应用前和应用过程中，应根据情况定期检查肝功能。出现血清 ALT 及 AST 增高时停止用药。(2) 治疗时应监测血铅浓度。因治疗后血铅浓度降低，但有些人再次接触铅和治疗时，血铅反而升高。此外，经短时治疗后，可引起血铅反跳性升高，这是因铅从骨中游离出来，重新分布的结果。所以应反复用药，才能保证疗效。(3) 监测尿铅的排出。(4) 每周监测全部血细胞计数，发现有中性粒细胞减少时停药。(5) 对一些缺乏葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶和镰状细胞性贫血儿童用本品治疗无效。(6) 服用本品的同时应饮足量水，脱水患者应在水分补足后再用药。

【禁忌证】(1) 严重肝功能不全患者禁用。(2) 孕妇禁用。

【不良反应】(1) 可见口、鼻呼气，汗，尿和便常带有大蒜样臭味。(2) 可见食欲缺乏、腹胀、恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应。(3) 偶见皮疹，血清 ALT 及 AST 一过性升高、中性粒细胞减少。

【用法与用量】口服。(1) 成人常用量：一次 0.5 g，一日 3 次，连服 3 日，停服 4 日，7 日为 1 疗程；或一次 0.5 g，一日 2 次，隔日服药，共 10 日，停服 5 日，15 日为 1 疗程；或按体重一次 10 mg/kg，每 8 小时 1 次，连服 5 日，以后每 12 小

时1次，连服14日，停服2周，33日为一疗程。根据病情，一般应用药2～3疗程。(2) 小儿常用量：按体重一次10 mg/kg，用法同成人。

【制剂与规格】二巯丁二酸胶囊：0.25 g。

二巯丙磺钠[保(甲)]

Sodium Dimercaptopropane Sulfonate

【适应证】(1) 用于汞、砷、锑、铋、铬和路易氏剂中毒。(2)用于毒蕈(noxious mushroom) 即野生毒蘑菇毒素毒肽、毒伞肽中毒。(3)用于沙蚕毒素类农药中毒。

【注意事项】(1) 高敏体质者应慎用或禁用，必要时脱敏治疗后密切观察下小剂量使用。(2) 一旦发生过敏反应须立即停药，并对症治疗。轻症者可用抗组胺药，反应严重者应用肾上腺素或肾上腺皮质激素。(3) 如需静脉注射，将本品250 mg用10%葡萄糖注射液20 ml稀释后使用。静脉注射速度要慢，应在5分钟以上注射完毕，否则会引起不良反应，故一般多采用肌内注射。(4) 由于本品与金属形成的络合物仍有一定程度的离解，如排泄慢，离解出来的二巯基化合物可很快被氧化，则游离的金属仍能产生中毒现象，故本品在金属中毒时，需反复给予足量的药物。

【禁忌证】对本品过敏或对巯基化合物有过敏史的患者。

【不良反应】(1) 静脉注射速度快时可引起恶心、呕吐、头晕、面色苍白、口唇发麻、心跳加快等，一般10～15分钟即可消失。(2) 偶见过敏反应，如皮疹、寒战、发热，甚至过敏性休克，剥脱性皮炎等。

【用法与用量】肌内注射。成人常用量：(1) 金属中毒：①急性中毒，一次250 mg，第1日3～4次，第2日2～3次，以后一日1~2次，连用7日为1疗程；②慢性中毒，一次125～250 mg，一日1～2次，连用3日，停药4日为1疗程，一般需用2～3个疗程。(2) 毒蕈中毒. 肌内注射，一次250 mg，一日2次，连用5～7日。(3) 沙蚕毒素类农药中毒：①轻、中度中毒，一次250 mg，6小时1次，用1日即可；②重度中毒：首剂静脉注射，剂量不变，其他仍肌内注射，第2日如病情需要再肌内注射，一次250 mg，用2～3次即可，间隔时间可延长至8～12小时。小儿常用量：按体重一次5 mg/kg，用法同成人。

【制剂与规格】二巯丙磺钠注射液：① 2 ml ：125 mg；② 5 ml ：250 mg。

青霉胺[保(甲)]

Penicillamine

【适应证】(1) 用于铅、汞等重金属中毒。(2) 用于肝豆状核变性和胱氨酸尿及其结石。

【注意事项】(1) 为防止发生过敏反应，使用前应做青霉素皮试。出现过敏反应时应立即停药，用小剂量药物脱敏，或用肾上腺皮质激素、抗组胺药物治疗。(2) 本品应每日连续服用。即使暂时停药数日，再次服用时亦可能发生过敏反应，因此又要从小剂量开始。长期服用本品应加用维生素B_6一日25 mg，以补偿所需要的增加量。(3) 本品可影响胚胎发育。动物实验发现有骨骼畸形和腭裂等。患有类风湿关节炎和胱氨酸尿的孕妇，在妊娠期服用本品曾报道其出生婴儿有发育缺陷。因此，孕妇应忌服。若必须服用，则每日剂量不超过1 g。预计孕妇需作剖宫产者，应在妊娠末6周起，到产后伤口愈合前剂量每日限在250 mg。(4) 65岁以上老人服用容易有造血系统毒性反应。(5) 口服铁剂患者，宜在服铁剂前2小时口服本品，以免减弱本品疗效。(6) 手术患者在创口未愈合时，每日剂量限制在250 mg。出现不良反应要减少剂量或停药。(7) 发生造血系统或肾功能损害时应视为严重不良反应，必须停药。(8) 肝豆状核变性病服本品1～3个月才见效，若治疗3～4个月无效时，则应停服本品，改用其他药物治疗。(9) 定期血、尿常规和肝功能检查：白细胞计数和分类、血红蛋白、血小板和尿常规等，在服药初6个月内至少每2周检查1次，以后至少每月1次；肝功能检查，至少每6个月1次，以便早期发现中毒性肝病和胆汁潴留。(10) 肝豆状核变性病患者初次应用本品

时，应在服药当天留24小时尿测尿铜，以后每3个月如法测定1次。

【禁忌证】(1) 对本品及青霉素类药过敏者禁用。(2) 孕妇禁用。(3) 肾功能不全患者禁用。(4) 粒细胞缺乏症、再生障碍性贫血患者禁用。

【不良反应】(1) 对青霉素过敏的患者，对本品也可能发生过敏反应。(2) 常见食欲缺乏、恶心、呕吐、溃疡病活动、口腔炎和溃疡。(3) 20%服药者有味觉异常。如发生味觉异常，除肝豆状核变性病患者外，可用4%硫酸铜溶液5～10滴，加入果汁中口服，每日2次，有助于味觉恢复。(4) 过敏反应，如皮肤瘙痒、荨麻疹、发热、关节疼痛和淋巴结肿大；其他皮肤反应包括狼疮样红斑和天疱疮样皮损。(5) 本品抑制皮肤胶原的交连，使皮肤变脆和渗血，并影响创口愈合。(6) 少见白细胞减少、粒细胞缺乏症、再生障碍性贫血、嗜酸性粒细胞增多，以及溶血性贫血和血小板减少性紫癜等。(7) 6%～20%服药者出现蛋白尿，有时有血尿和免疫复合物型肾小球肾炎所致的肾病综合征。(8) 偶见脱发、胆汁潴留、肺出血－肾炎综合征 (Goodpasture Syndrome)、重症肌无力和耳鸣，以及免疫球蛋白A(IgA)降低。

【用法与用量】口服。(1) 成人常用量：①铅、汞等重金属中毒：一次0.125～0.375 g，一日4次，5～7日为1疗程，停药2日后开始新疗程，一般治疗1～3个疗程；②肝豆状核变性：开始一日0.125～0.25 g，以后每1～2个月增加0.125～0.25 g，维持量一次0.25 g，一日4次，最大量一日1.5 g，一般需用药6～12个月；③胱氨酸尿：用量参考尿中胱氨酸排出量而定，长期服用。一次0.25～0.5 g，一日4次，最大量一日2 g。有结石的患者，一日要求尿中排出胱氨酸100 mg以下，无结石患者一日尿中排出胱氨酸100～200 mg。(2) 小儿常用量：按体重一次10 mg/kg，一日3次，或一次15 mg/kg，一日2次，最大量一次250 mg，用法同成人。

【制剂与规格】青霉胺片：①0.125 g；②0.25 g。

去铁胺 [保(甲)]

Deferoxamine

【适应证】用于急性铁中毒、输血性铁质沉着病和慢性肾衰竭伴铝负荷过量，如透析性铝脑病和铝骨病。

【注意事项】(1) 肾盂肾炎患者慎用。(2) 孕妇不宜应用，尤其对妊娠3个月内的孕妇。(3) 哺乳期妇女慎用。(4) 3岁以下小儿一般不用。这是因为地中海性贫血患儿体内铁负荷量不多，同时本品对小儿容易引起眼和耳的损害。(5) 老年人应用本品时，不宜同时加用大剂量维生素C，否则容易导致心脏失去代偿功能。(6) 注射本品时应注意过敏反应和静脉滴注速度。在长期用药过程中要随访血浆铁蛋白和肝肾功能，每3个月检查视力和听力。(7) 治疗急性铁中毒应肌内注射；当休克时，可以静脉滴注；一旦休克控制，应改为肌内注射，以避免药物不良反应。给药前、给药后2～6小时和以后应测定血清铁、总铁结合力、铁蛋白和尿铁胺（呈橘红色）。若给药后2小时尿无变色，且患者无中毒症状，提示体内铁负荷无过量，无需继续给药。但要警惕有些严重中毒患者的尿色在用药后不一定变色。急性铁中毒患者即便无中毒症状，亦应观察至少24～48小时。(8) 输血性铁质沉着病的给药途径以肌内注射或皮下注射为宜。皮下注射的效果与静脉注射相似，但要比肌内注射大2～3倍。皮下注射部位可选择腹壁，需用微型泵作为驱动力缓慢皮下输注。皮下输注或静脉滴注每次需时8～12小时，个别可至24小时。(9) 为增强本品的作用可以口服维生素C，一日总量不超过200mg，并应分次服用，给药时间应在开始应用本品后的1～2周。

【禁忌证】(1) 对本品过敏者禁用。(2) 严重肾功能不全患者禁用。

【不良反应】(1) 少见过敏反应。(2) 对本品过敏的患者或静脉注射速度过快时可出现皮肤潮红、心动过速甚至休克。此时，及时用抗组胺药或抗休克药物，可使反应缓解。(3) 长期用药可导致视力减退、视野缩小、辨色和夜视困难、视网膜色素异常和白内障。耳鸣和听力减退可在

视力受影响时同时出现，亦可急性起病。眼和耳的损害停药后可有部分或完全恢复。(4) 少见眩晕、惊厥、腿部肌肉痉挛、腹痛、腹泻、心动过速、心律失常、血小板减少、排尿困难和发热。(5) 本品有激发和加重隐匿性肾盂肾炎，还增加耶雪尼肠结肠菌 (Yersinia enteroclitica) 引起的肠道感染。发生肠炎时应停药，并用抗生素治疗。(6) 肌内注射局部有疼痛。

【用法与用量】肌内注射、皮下注射或静脉滴注。肌内注射、皮下注射：将本品0.5 ~ 1 g，用灭菌注射用水 2 ml 溶解后使用。静脉滴注：将本品 0.5 ~ 1 g，用氯化钠注射液、复方氯化钠注射液或5%葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 溶解后滴注，滴注时间 1 ~ 2 小时，滴注速度按体重每小时不超过 15 mg/kg，24 小时总量不超过 90 mg/kg。(1) 急性铁中毒：①成人常用量：肌内注射，首次 1 g，以后每 4 小时给予 0.5g，共 2 次。根据病情可继续每 4 ~ 12 小时给予 1 次 0.5 g，但 24 小时内总量不应超过 6 g。静脉滴注，剂量同肌内注射。②小儿常用量：静脉滴注，按体重一次 20 mg/kg，每 6 小时 1 次，其他同成人。(2) 输血性铁质沉着病：①成人常用量：肌内注射，一次 0.5 ~ 1 g，一日 1 次，轻症一周 3 ~ 5 次，重症一周 5 ~ 7 次。皮下注射或静脉滴注，按体重一次 20 ~ 40 mg/kg，一日 1 次，轻症一周 3 ~ 5 次，重症一周 5 ~ 7 次。②小儿常用量：皮下注射或静脉滴注，按体重一次 10 mg/kg，一日 1 次，轻症一周 3 ~ 5 次，重症一周 5 ~ 7 次。(3) 慢性肾衰竭伴铝负荷过量：成人常用量，按体重一次 20 mg/kg，一周 1 ~ 2 次，在透析初 2 小时通过动脉留置导管滴注，一周总量一般不超过 6 g。

【制剂与规格】注射用甲磺酸去铁胺：0.5 g。

巯乙胺[保(甲)]

Mercaptamine

【适应证】用于治疗金属中毒（对急性四乙基铅中毒效果较好）及预防和治疗放射病综合征（如全身无力、恶心、呕吐、嗅觉和味觉障碍等）。

【注意事项】(1) 开始注射 2 ~ 3 次后不见奏效，则不宜继续使用。(2) 静脉注射时宜取卧位，注射速度宜缓慢。(3) 注射液切勿接触金属物，以免色变暗或发生沉淀。(4) 偶可出现呼吸抑制，可给氧及注射咖啡因、野靛碱等进行对症治疗。

【禁忌证】严重肝、肾功能不全者禁用。

【不良反应】可见恶心、呕吐、倦睡、不适、畏食、腹部绞痛、潮红、过敏、假性脑膜炎、白细胞减少、室性心动过速。

【用法与用量】(1) 治疗金属中毒：急性中毒，静脉注射，一次 0.2 g，一日 1 ~ 2 次，症状改善后可逐渐减量；慢性中毒，肌内注射，一次 0.2 g，一日 1 次，10 ~ 20 日为 1 疗程。(2) 防止放射病：预防时，首次照射 10 ~ 30 分钟后，静脉注射 100 ~ 200 mg，必要时每隔 5 ~ 7 日重复注射，在一次放射治疗中共注射 4 ~ 7 次；治疗，可按同剂量注射 5 ~ 7 次。

【制剂与规格】巯乙胺注射液：2 ml：200 mg。

19.2.2.2 有机磷毒物中毒解毒药

有机磷毒物系指一类分子结构中含有机磷酸酯的化合物，可用作有机磷农药和战时用作神经性毒剂。有机磷毒物进入机体后主要表现为对乙酰胆碱酯酶和丁酰胆碱酯酶的活性具有强力的抑制作用，其磷酰根与酶的活性部分紧密结合，形成磷酰化胆碱酯酶（中毒酶），使胆碱酯酶失去水解神经递质乙酰胆碱的能力，致使组织中乙酰胆碱过量蓄积，引起中枢神经系统和胆碱能神经过度兴奋，而后抑制或衰竭，引起一系列症状、体征等中毒反应。

有机磷毒物中毒的反应有三种：毒蕈碱 (muscarine, M) 样作用，烟碱 (nicotine, N) 样作用，中枢神经系统作用。有机磷毒物中毒的治疗主要是根据中毒过程的不同环节采取相应的治疗措施：①按中毒途径（皮肤、胃肠道）进行皮肤清洗或洗胃，中断毒物的接触途径，清除未被机体吸收的毒物；②应用胆碱酯酶复活剂，使中毒酶恢复活性，即恢复催化水解乙酰胆碱的能力；③应用生理拮抗剂，对抗各种中毒作用；④对症支持治疗。其中第②条和第③条通称为解毒治疗，所应用的药物即为

有机磷中毒的解毒剂。从上可知，有机磷中毒的解毒剂有两类，即胆碱酯酶复活剂与生理拮抗剂。

胆碱酯酶复能剂是在有机磷毒物中毒过程中，恢复未老化的被抑制的胆碱酯酶的活性。常用的重活化剂为吡啶醛肟类化合物，如氯解磷定、碘解磷定、双复磷及双解磷等，我国最常用的是前两种。双复磷为双季铵肟类，分子中有两个肟基，因此在使用相同剂量时，重活化作用比碘解磷定和氯解磷定强，且有较弱的阿托品样作用，脂溶性较高，能部分透过血－脑脊液屏障，中枢作用较其他吡啶醛肟类重活化剂好，但目前国内尚无生产，所以较少使用。双解磷也为双季铵肟类，因此在使用相同剂量时重活化作用比碘解磷定大 3.5 ~ 6 倍，与双复磷相当，但不能透过血－脑脊液屏障。阿托品样作用及对神经－肌肉接头的作用比碘解磷定强，特别在缓解毒蕈碱样症状方面较好。但副作用大，对心脏、肝脏均有损害，所以目前我国已很少使用。

生理拮抗剂主要为抗胆碱药，常用的有以周围抗胆碱能作用为主的阿托品，以中枢抗胆碱能作用为主的东莨菪碱和新型抗胆碱药盐酸戊乙奎醚。

其他生理拮抗剂，如贝那替秦、苄托品、丙环定等皆为以中枢抗胆碱能作用为主的抗胆碱药，多在复方中使用，极少单独应用。如解磷注射液，系由阿托品、贝那替秦、氯解磷定等组成的复方制剂，既有对抗有机磷中毒的外周毒蕈碱样和烟碱样的作用，也能对抗中枢神经系统中毒症状，同时能使磷酰化胆碱酯酶重活化，起到标本兼治的作用。

碘解磷定[保(甲)]

Pralidoxime Iodide

【适应证】用于有机磷毒物中毒。单独应用疗效差，应与抗胆碱药物联合应用。

【注意事项】(1) 本品对中毒时间不长的患者疗效较好，对被有机磷毒物（杀虫剂）抑制超过 36 小时已“老化”的胆碱酯酶的复能作用效果甚差。因此，应用本品治疗有机磷毒物中毒时，用药越早越好。对慢性有机磷杀虫剂中毒抑制的胆碱酯酶无复活作用。(2) 本品对不同品种有机磷毒物中毒的疗效不同。一般认为对沙林、对硫磷、内吸磷、硫特普、马拉硫磷、乙硫磷的疗效较好；对塔崩、敌敌畏、美曲膦酯的效果较差；对索曼无效；对乐果、氧化乐果尚有争议。(3) 本品虽能迅速消除肌肉震颤、肌无力等外周性烟碱样症状，但不能直接对抗乙酰胆碱的大部分效应，即不能消除中枢症状、毒蕈碱样症状及其他烟碱样症状，故对中、重度有机磷毒物中毒患者，必须与抗胆碱药合用。(4) 本品不易透过血－脑脊液屏障进入中枢神经系统，对中枢的中毒酶没有明显的重活化作用，故对中毒的中枢症状无明显效果。(5) 根据病情掌握剂量及间隔时间，用药过程中应密切观察病情变化及测定血液胆碱酯酶活性，以作为用药指标。有机磷农药口服中毒时，由于有机磷可在下消化道吸收及排泄较慢，因此这类患者应用本品至少要维持 48 ~ 72 小时。停药指征以烟碱样症状（肌颤、肌无力）消失为主，血液胆碱酯酶活性应维持在 50% ~ 60% 或以上。(6) 本品在碱性溶液中容易水解，不能与碱性药物配伍使用。(7) 老年中毒患者应适当减少用量和减慢静脉注射速度。(8) 本品生物半衰期短，不宜静脉滴注。

【禁忌证】对本品及碘过敏的患者禁用。

【不良反应】(1) 注射速度过快可引起恶心、呕吐、心率增快，严重时有乏力、头痛、眩晕、视物模糊、复视、动作不协调等。(2) 大剂量或注射速度过快时可引起血压波动、呼吸抑制等。(3) 偶见咽痛和腮腺肿大等碘反应。(4) 本品对局部组织刺激性较强，静脉注射时如漏至皮下可致剧痛及周围皮肤发麻。

【用法与用量】注射液：可直接缓慢静脉注射，每 0.4~0.8 g 注射时间为 10~15 分钟。粉针剂：临用前，将本品 0.4 ~ 0.8 g 用氯化钠注射液、5% 葡萄糖注射液或 10% 葡萄糖注射液 20 ~ 40 ml 溶解后缓慢静脉注射，注射时间 10 ~ 15 分钟。静脉注射：(1) 成人常用量：①轻度中毒，一次 0.4 ~ 0.8 g，必要时 1 小时后重复用药 1 次；②中度中毒，首次 0.8 ~ 1.6 g，以后每 1 小时重复 0.4 ~ 0.8 g，肌颤缓

解或血液胆碱酯酶活性恢复至正常的60%以上后酌情减量或停药；③重度中毒，首次1.6~2.4g，以后每1小时重复0.8~1.6g，肌颤缓解或血液胆碱酯酶活性恢复至正常的60%以上后酌情减量或停药。(2) 小儿常用量：①轻度中毒，按体重一次15mg/kg；②中度中毒，按体重一次20~30mg/kg；③重度中毒，按体重一次30mg/kg。用法同成人。

【制剂与规格】碘解磷定注射液：①10ml：0.4g；②20ml：0.5g。

注射用碘解磷定：0.4g。

氯解磷定[保(甲)]

Pralidoxime Chloride

【适应证】用于有机磷毒物中毒。单独应用疗效差，应与抗胆碱药联合应用。

【注意事项】(1) 本品对马拉硫磷、美曲膦酯、敌敌畏、乐果、甲氟磷、丙胺氟磷和八甲磷等的中毒效果较差；对氨基甲酸酯杀虫剂所抑制的胆碱酯酶无复活作用。(2) 本品可用于对碘及碘解磷定过敏者。(3) 老年中毒患者应适当减少用量，减慢静脉注射速度。(4) 本品在碱性溶液中容易分解失效，禁与碱性药物配伍。(5) 有机磷毒物中毒患者越早应用本品越好。皮肤吸收引起中毒的患者，应用本品的同时要脱去被污染的衣服，并用肥皂清洗头发和皮肤；眼部用2.5%碳酸氢钠溶液和灭菌氯化钠等渗溶液冲洗；口服中毒患者用2.5%碳酸氢钠溶液彻底洗胃。由于有机磷毒物可在下消化道吸收，因此口服患者应用本品至少要维持48~72小时，以防引起延迟吸收后加重中毒，甚至致死。停药指征以烟碱样症状（肌颤、肌无力）消失为主。昏迷患者要保持呼吸道通畅，呼吸抑制应立即进行人工呼吸。(6) 用药过程中要随时测定血胆碱酯酶作为用药监护指标。要求血胆碱酯酶维持在50%~60%或以上。急性中毒患者的血胆碱酯酶水平与临床症状有关，因此密切观察临床表现，亦可及时重复应用本品。(7) 本品有效血药浓度为4mg/L，相当于2.3×10^{-5}mol/L；最高重活化作用的浓度是17.2mg/L（1×10^{-4}mol/L）。由于排泄快，半衰期短，静脉滴注不能达到有明显疗效的血药浓度，故治疗有机磷毒物中毒时不宜采用静脉滴注方式给药。(8) 本品口服吸收不规则，不能达到有效的血药浓度；剂量相同时，静脉注射较肌内注射能达到更高的血药浓度，较高的血药浓度维持时间也较长；肌内注射吸收迅速，能达到有效的血药浓度，应用比较方便，不易出现副作用。人肌内注射氯解磷定30mg/kg，5分钟血药浓度为20mg/L，20分钟为15mg/L，90分钟为9mg/L，说明肌内注射效果不低于静脉注射。总结既往有机磷农药中毒的治疗经验，氯解磷定首次用量以30mg/kg（1.5~2.0g/人）肌内注射或静脉注射效果较好。

【不良反应】(1) 静脉注射的反应与碘解磷定相同，注射速度过快可引起恶心、呕吐、心率增快，严重时有头痛、眩晕、视物模糊、复视、动作不协调等，但比碘解磷定反应小。(2) 药物的局部刺激性大，肌内注射局部疼痛，但通常能忍受。

【用法与用量】肌内注射或静脉注射。用于肌内注射时，本品可直接使用；用于静脉注射时，临用前，应将本品0.75~1g用氯化钠注射液20~40ml稀释后缓慢静脉注射，注射时间5~10分钟。(1) 成人常用量：①轻度中毒，一次0.5~0.75g，肌内注射，必要时1小时后重复1次；②中度中毒，首次0.75~1.5g，肌内注射或静脉注射，以后每1小时重复0.5~1.0g，直至肌颤消失或血液胆碱酯酶活性恢复至正常的60%以上后酌情减量或停药；③重度中毒，首次1.5~2.5g，分两处肌内注射或静脉注射，以后每0.5~1小时重复1.0~1.5g，直至肌颤消失或血液胆碱酯酶活性恢复至正常的60%以上后酌情减量或停药。(2) 小儿常用量：①轻度中毒，按体重一次15~20mg/kg；②中度中毒，按体重一次20~30mg/kg；③重度中毒，按体重一次30mg/kg。用法同成人。

【制剂与规格】氯解磷定注射液：①2ml：0.25g；②2ml：0.5g。

双复磷[保(甲)]

Obidoxime Chloride

【适应证】用于有机磷中毒。

【注意事项】对中度及重度中毒者仍应联合使用阿托品。其他参见碘解磷定。

【不良反应】注射过快可引起全身发热、口干、面部潮红、恶心、呕吐，严重者可引起神经肌肉传导阻滞、心律失常。偶见中毒性黄疸。

【用法与用量】肌内注射或静脉注射。成人常用量：(1) 轻度中毒：肌内注射，一次 0.125 ~ 0.25 g，必要时 2 ~ 3 小时后重复 1 次。(2) 中度中毒：肌内注射或静脉注射，一次 0.5 g，2 ~ 3 小时后再注射 0.25 g，必要时重复 2 ~ 3 次。(3) 重度中毒：缓慢静脉注射，首次 0.5 ~ 0.75 g，2 小时后再注射 0.5 g，以后根据病情可重复使用，并酌情减量。

【制剂与规格】双复磷注射液：2 ml : 0.25 g。

硫酸阿托品[保(甲)]

Atropine Sulfate

【适应证】用于有机磷毒物中毒。单独应用疗效差，应与胆碱酯酶复活剂联合应用。

【注意事项】(1) 治疗有机磷毒物中毒，特别是经口严重中毒时，要求达到阿托品化，即出现口干、皮肤干燥、面色潮红，心率增快至每分钟 100 次左右，体温 37.3 ~ 37.5℃，或有小躁动（此为正常的治疗反应，不属于药物不良反应范畴）。(2) 阿托品严重过量或中毒时，可出现谵妄、狂躁、两手抓空、胡言乱语、幻听幻视、定向力丧失、昏迷等症状，心率快至每分钟 120 次以上，体温高达 38 ~ 40℃，甚至发生肺水肿及脑水肿而危及生命。(3) 治疗有机磷毒物中毒时，为了获得最好的疗效，阿托品必须与胆碱酯酶复活剂伍用。胆碱酯酶复活剂不仅能恢复中毒胆碱酯酶的活性起治本作用，且对有机磷毒物引起的外周 N 样症状（肌颤、肌无力、肌麻痹等）有直接对抗作用，弥补了阿托品作用的不足。

【用法与用量】肌内注射或静脉注射。肌内注射时，本品可直接使用；静脉注射时，将本品 2 ~ 5 mg，用 25% 葡萄糖注射液或 50% 葡萄糖注射液 10 ~ 20 ml 稀释后缓慢静脉注射，注射时间 5 ~ 10 分钟。(1) 成人常用量：①轻度中毒，一次 1 ~ 3 mg，静脉注射，15 ~ 30 分钟 1 次，阿托品化后逐渐改为一次 0.5 ~ 1 mg，肌内注射，2 ~ 6 小时 1 次，疗程 3 ~ 5 日。②中度中毒，一次 5 ~ 10 mg，静脉注射，15 ~ 30 分钟 1 次，阿托品化后逐渐改为一次 1~4 mg，静脉注射或肌内注射，1~6 小时 1 次，疗程 5 ~ 7 日。③重度中毒，一次 10 ~ 20 mg，静脉注射，10 ~ 15 分钟 1 次，阿托品化后逐渐减量，延长间隔时间，疗程 7 ~ 10 日。(2) 小儿常用量：用量可根据体重折算，用法同成人。

【制剂与规格】硫酸阿托品注射液：① 1 ml : 0.5 mg；② 1 ml : 1 mg；③ 1 ml : 2 mg；④ 2 ml : 5 mg；⑤ 2 ml : 10 mg。

氢溴酸东莨菪碱[保(乙)]

Scopolamine Hydrobromide

【适应证】用于有机磷毒物中毒。

【不良反应】与阿托品相同，但中枢神经系统症状更明显。常见口干，眩晕，严重时瞳孔散大，皮肤潮红，灼热，兴奋，烦躁，谵语，惊厥，心跳加快。

【用法与用量】皮下注射、肌内注射、静脉注射或静脉滴注。用于皮下注射、肌内注射和静脉注射时，本品可直接使用；用于静脉滴注时，将本品 0.6 ~ 2.0 mg 用 5% 葡萄糖注射液或 10% 葡萄糖注射液 500 ml 稀释后使用。(1) 成人常用量：首次剂量，轻度中毒 0.3 ~ 0.5 mg，中度中毒 0.5 ~ 1.0 mg，重度中毒 2.0 ~ 4.0 mg；重复用药剂量，一次 0.3 ~ 0.6 mg。(2) 小儿常用量：尚不明确。

【制剂与规格】氢溴酸东莨菪碱注射液：① 1 ml : 0.3 mg；② 1 ml : 0.5 mg；③ 2 ml : 2 mg。

盐酸戊乙奎醚

Penehyclidine Hydrochloride

【适应证】用于有机磷毒物中毒急救治疗和中毒后期或胆碱酯酶（ChE）老化

后维持阿托品化。单独应用疗效差，应与胆碱酯酶重活化剂联合应用。

【注意事项】(1) 本品对心脏（M_2受体）无明显作用，故对心率无明显影响。(2) 本品不能以心跳加快来判断是否“阿托品化”，而应以口干和出汗消失或皮肤干燥等症状判断“阿托品化”。(3) 心跳不低于正常值时，一般不需伍用阿托品。(4) 孕妇及哺乳期妇女每次用药间隔时间不宜过短，剂量不宜过大。(5) 儿童对本药较敏感，应当慎用，特别是伴有高热的病人更应当慎重。(6) 本品对前列腺肥大的老年患者可加重排尿困难，用药时应严密观察。

【不良反应】用量适当时常常伴有口干，面红和皮肤干燥等。如用量过大，可出现头晕，尿潴留，谵妄和体温升高等。一般不须特殊处理，停药后可自行缓解。

【用法与用量】肌内注射。(1) 成人常用量：轻度中毒，首次 1 ~ 2 mg，必要时伍用氯解磷定 250 ~ 750 mg；中度中毒，首次 2 ~ 4 mg，同时伍用氯解磷定 750 ~ 1 500 mg；重度中毒，首次 4 ~ 6 mg，同时伍用氯解磷定 1 500 ~ 2 500 mg。首次用药 45 分钟后，如仅有恶心，呕吐，出汗，流涎等毒蕈碱样症状时，仅需应用盐酸戊乙奎醚 1 ~ 2 mg 即可；如仅有肌颤，肌无力等烟碱样症状或胆碱酯酶活力低于 50% 时，仅需应用氯解磷定 1 000 mg 即可，无氯解磷定时可用碘解磷定代替；如上述症状均有时，则需重复应用盐酸戊乙奎醚和氯解磷定首次用量的半量 1 ~ 2 次。中毒后期或胆碱酯酶老化后可用盐酸戊乙奎醚 1 ~ 2 mg 维持阿托品化，每次间隔 8 ~ 12 小时。急性有机磷毒物轻、中、重度中毒的用药总量分别为 2 ~ 3 mg、5 ~ 7 mg、10 ~ 14 mg。(2) 小儿常用量：参照成人用量。

【制剂与规格】盐酸戊乙奎醚注射液：1 ml ∶ 1 mg。

19.2.2.3 氰化物中毒解毒药

氰化物系指分子中含有氰基（−CN）的化合物，其中的碳原子和氮原子通过叁键相连接（HC≡N）。氰化物是一类剧毒物，常见的有氰化氢、氰化钠、氰化钾、氰化钙及溴化氰等无机类和乙腈、丙腈、丙烯腈、正丁腈等有机类，另外某些植物果实中如苦杏仁、桃仁、李子仁、枇杷仁、樱桃仁及木薯等都含有氰苷，分解后可产生氢氰酸。

中毒机制。氰化物进入体内后释放出氰离子（CN^-），可抑制线粒体中细胞色素氧化酶的活性。在生理情况下氧化型细胞色素氧化酶分子中的三价铁（Fe^{3+}）获得电子后变为还原型细胞色素氧化酶（Fe^{2+}），后者遇氧分子时，又变为氧化型细胞色素氧化酶，并把电子传给氧分子生成氧离子，氧离子与氢结合成水。通过这一可逆的氧化还原反应，细胞色素氧化酶起着传递电子的作用。氰化物中毒时，CN^-与氧化型细胞色素氧化酶的Fe^{3+}有高度亲和力，结合生成氰化高铁细胞色素氧化酶，阻止Fe^{3+}还原为Fe^{2+}，使电子传递中断，抑制细胞的有氧代谢，导致细胞缺氧窒息。组织细胞不能利用氧，而出现全身各系统的缺氧症状，以中枢神经系统最为突出。

解毒机制。氰化物中毒的解毒药有两种作用机制。一种机制是利用高铁血红蛋白与氰离子结合形成氰化高铁血红蛋白，使被抑制的细胞色素氧化酶恢复活性，解除组织缺氧。常用药物主要有高铁血红蛋白形成剂，如亚硝酸钠、亚硝酸异戊酯与亚甲蓝等。另一种机制是利用钴螯合物羟钴胺、依地酸二钴等直接与氰离子结合，形成稳定的、无毒的氰钴胺、钴氰螯合物从尿中排出。

亚硝酸钠和亚硝酸异戊酯是目前我国常用的高铁血红蛋白形成剂。亚硝酸钠催化高铁血红蛋白形成的作用为 4.5 ~ 9 分钟。对氨基苯丙酮形成高铁血红蛋白的速度比亚硝酸钠缓慢，因此不适合氰化物中毒的急救使用，但其形成高铁血红蛋白后维持时间长、副作用小、口服吸收好，可作为氰化物中毒的预防药。亚甲蓝形成高铁血红蛋白的作用快、副作用小，但其形成高铁血红蛋白的能力不如亚硝酸钠，且作用时间短，大剂量能导致溶血，现已不采用。

羟钴胺和依地酸二钴作用快、解毒能力强，但前者制剂不稳定、用量太大、可

出现过敏反应，用前需做过敏试验，后者毒性大。

亚硝酸钠[保(甲)]

Sodium Nitrite

【适应证】用于氰化物中毒。

【注意事项】(1) 病人出现休克时，应当充分抗休克后再使用本品。(2) 注射本品时，要停止吸入亚硝酸异戊酯，同时注意血压变化，一旦收缩压降至 80 mmHg 时，应立即停止给药。(3) 本品不得与硫代硫酸钠混合注射，否则将加重不良反应，血压明显下降。(4) 如用量过大而导致形成过多的高铁血红蛋白时，可静脉注射 1% 亚甲蓝溶液 5 ~ 10 ml (0.1 ~ 0.2 ml/kg)，以促进高铁血红蛋白还原为血红蛋白。(5) 对儿童患者，要特别注意本品的使用剂量。(6) 本品必须在中毒早期应用，使用愈早效果愈好。

【禁忌证】休克患者禁用。

【不良反应】(1) 本品有扩张血管作用，注射速度过快时，可致血压下降、心动过速、头痛、出冷汗，甚至晕厥、休克、抽搐。(2) 用量过大时引起高铁血红蛋白血症，从而出现严重发绀、呼吸困难等症状。

【用法与用量】静脉注射。本品可以直接缓慢静脉注射，注射速度每分钟 0.06~0.09 g (3%溶液 2 ~ 3 ml)；或将本品 0.3 ~ 0.45 g 用氯化钠注射液 100 ml 稀释后缓慢静脉注射，注射时间 5 ~ 20 分钟。(1) 成人常用量：一次 0.3~0.45 g 或 3% 溶液 10 ~ 15 ml。本品注射完毕后，随即用同一针头及相同速度静脉注射 25% 硫代硫酸钠溶液 40 ml，必要时 0.5 ~ 1 小时后可重复本品和硫代硫酸钠半量或全量。(2) 小儿常用量：按体重一次 4.5~9 mg/kg 或 3% 溶液 0.15~0.30 ml/kg。用法同成人。小儿最好根据血液中血红蛋白的含量调整亚硝酸钠的用量，见表 19-1。

表 19-1 小儿血红蛋白含量与 3% 亚硝酸钠用量对照表

血红蛋白 (g/L)	3% 亚硝酸钠用量 (ml/kg)
70	0.19
80	0.22
90	0.25
100	0.27
110	0.30
120	0.33
130	0.36
140	0.39

【制剂与规格】亚硝酸钠注射液：10 ml : 0.3 g。

亚硝酸异戊酯[保(甲)]

Amyl Nitrite

【适应证】用于氰化物中毒。

【注意事项】(1) 本品降低血压，故老年人和有心血管疾病的患者慎用。(2) 接触本品可导致接触性皮炎。(3) 本品有易燃性，不可近火。其余同亚硝酸钠。

【禁忌证】(1) 休克患者禁用。(2) 青光眼、近期脑外伤或脑出血患者禁用。

【不良反应】(1) 吸入后因血管扩张可致剧烈头痛、暂时性血压下降、心动过速，甚至晕厥。(2) 用量过大时，形成过多的高铁血红蛋白而出现头晕、心悸、气短等缺氧症状。

【用法与用量】鼻腔吸入。使用方法：将本品安瓿包在一层手帕或纱布内压碎或折断后给患者经鼻腔吸入。(1) 成人常用量：一次 0.2 ~ 0.4 ml，每次吸 15 秒钟，每 2 ~ 3 分钟 1 次，直至开始静脉注射亚硝酸钠为止。总量不超过 1 ~ 1.2 ml。(2) 小儿常用量：同成人。

【制剂与规格】亚硝酸异戊酯吸入剂：0.2 ml。

硫代硫酸钠[保(甲)]

Sodium Thiosulfate

【适应证】与高铁血红蛋白形成剂联合应用，用于氰化物中毒。

【注意事项】(1) 静脉注射量大时，应注意不良反应，注射速度不宜过快，以免引起血压下降。(2) 不能与亚硝酸钠混合同时静脉注射，以免血压下降。(3) 不能与其他药物混合注射，否则发生沉淀或降低疗效。(4) 口服中毒者，还须用本品 50%溶液洗胃，以减少肠道内氰化物的吸收。

【不良反应】(1) 偶见头晕、乏力、恶心、呕吐等。(2) 静脉注射速度过快时可引起血压下降。

【用法与用量】静脉注射。临用前，将本品 10 ~ 15 g 用灭菌注射用水或氯化钠注射液 40 ~ 60 ml 溶解，制成 25 % 的溶液缓慢静脉注射，注射速度一分钟 2.5 ~ 5 ml。(1) 成人常用量：注射高铁血红蛋白形成剂后，立即缓慢静脉注射 10 ~ 15 g，必要时 1 小时后再与高铁血红蛋白形成剂联合重复使用半量或全量。(2) 小儿常用量：按体重一次 0.25 ~ 0.375 g/kg。用法同成人。在静脉注射亚硝酸钠后，不需拔出针头，立即由原注射针头注射本品。

【制剂与规格】注射用硫代硫酸钠：① 0.5 g（以 $Na_2S_2O_3 \cdot 5H_2O$ 计，相当于 $Na_2S_2O_3$ 0.32 g）；② 1 g（以 $Na_2S_2O_3 \cdot 5H_2O$ 计，相当于 $Na_2S_2O_3$ 0.64 g）。

19.2.2.4 亚硝酸盐中毒解毒药

亚硝酸盐中毒，亦称肠源性青紫症。白菜、青菜、韭菜、菠菜、山芋等蔬菜及新鲜腌菜、熟的剩菜剩饭和水中都含有硝酸盐，正常情况下不会引起中毒，但进食变质的蔬菜、食物或含硝酸盐较多的食物，硝酸盐会在细菌作用下还原为亚硝酸盐从而引起中毒。亚硝酸盐量达 0.2 ~ 0.5 g 即可引起中毒，主要作用于血管运动中枢和血液。亚硝酸盐自肠道吸收后，进入血液发生氧化作用，使血液中供组织输氧的低铁血红蛋白氧化成失去输氧能力的高铁血红蛋白。这种高铁血红蛋白在血液中超过 10%（1.5 g）时，就会引起组织缺氧，产生发绀。

亚硝酸盐中毒危重者应静脉注射 1% 亚甲蓝解毒。

亚甲蓝 [保(甲)]

Methylthioninium Chloride

【适应证】用于亚硝酸盐（包括烂白菜及腌渍不好的蔬菜、酸菜等）及苯胺类化合物中毒引起的高铁血红蛋白血症。

【注意事项】(1) 本品不能皮下及肌内注射，否则可引起注射局部组织坏死；不能椎管内注射，否则可引起中枢神经系统器质性损害。(2) 静脉注射速度不可过快，一般注射稀释后溶液一分钟 2 ml 左右。一次注射剂量不得超过 200 mg，24 小时总量不得超过 500 mg。(3) 治疗高铁血红蛋白血症时，本品一日用量约 120 mg 即可，重者可用 2 ~ 3 日，不需大量反复应用。因本品完全排泄需 3 ~ 5 日，大量反复使用可导致体内蓄积引起与治疗相反的结果。(4) 对先天性还原型辅酶 Ⅱ (NADPH) 及高铁血红蛋白还原酶缺乏引起的高铁血红蛋白血症效果差，可一日口服本品 300 mg，并给予大剂量维生素 C。对异常血红蛋白 M 病伴有高铁血红蛋白血症无效。(5) 葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶缺乏患者和小儿应用剂量过大可引起溶血。(6) 肾功能不全者慎用。

【不良反应】(1) 静脉注射过快，可引起头晕、恶心、呕吐、胸闷、腹痛等；剂量过大时除上述症状加剧外，还可引起头痛、呼吸困难、血压降低、心率增快和心律紊乱、大汗淋漓、意识障碍，严重时有心肌损害。(2) 用药后尿呈蓝绿色，有时可产生尿路刺激症状，如尿道灼痛等。

【用法与用量】静脉注射。临用前，将本品 50 ~ 100 mg (1% 溶液 5 ~ 10 ml) 用 5% ~ 25% 葡萄糖注射液 20 ~ 40 ml 稀释后缓慢静脉注射，注射时间 10 ~ 12 分钟。(1) 成人常用量：首次按体重一次 1 ~ 2 mg/kg。若静脉注射 30 ~ 60 分钟后皮肤黏膜发绀不消退，可按原量重复注射 1 次。以后可视病情每 2 ~ 4 小时重复注射半量，直至皮肤黏膜青紫明显好转或高铁血红蛋白降至 10% 左右。每次不超过 200 mg，每日不超过 600 mg。(2) 小儿常用量：按体重一次 1 ~ 2 mg/kg。用法同成人。

【制剂与规格】亚甲蓝注射液：① 2 ml ∶ 20 mg；② 5 ml ∶ 50 mg；③ 10 ml ∶ 100 mg。

19.2.2.5 灭鼠药中毒解毒药

根据灭鼠药进入鼠体后作用的快慢，灭鼠药物分为急、慢性两类。急性灭鼠药包括磷化锌、氟乙酰胺、氟乙酸钠、毒鼠磷、毒鼠强、溴代毒鼠磷、溴甲灵、敌溴灵等。氟乙酰胺和毒鼠强由于毒性强，无

特效解毒剂，很容易引起人、畜中毒，国家已明令禁用。慢性灭鼠药，可分第一代、第二代抗凝血灭鼠剂，第一代包括敌鼠钠、杀鼠灵、杀鼠迷（立克命）、杀鼠酮、氯敌鼠等；第二代包括溴敌隆、大隆、杀它仗、硫敌隆等。

目前临床上常见的灭鼠药中毒是毒鼠强、氟乙酰胺和氟乙酸钠中毒。常用解毒药：氟乙酰胺、氟乙酸钠中毒的特效解毒药乙酰胺（解氟灵）；抗凝血灭鼠剂特效解毒药维生素 K_1。毒鼠强中毒目前尚无特效解毒药，早期使用苯巴比妥钠有拮抗作用，可推迟死亡时间，降低死亡率。

乙酰胺 [保（甲）]

Acetamide

【适应证】用于氟乙酰胺、氟乙酸钠等有机氟化合物中毒。

【不良反应】本品使用剂量过大或长期用药可引起血尿。

【注意事项】(1) 所有氟乙酰胺、氟乙酸钠等有机氟化合物中毒病人，包括可疑中毒者，不管发病与否，更不要等待毒物检查结果，应及时给予本品，以免贻误治疗时机。早期应给予足量。(2) 对有机氟化合物中毒患者，不论病程早晚，给予本品后都有一定作用。早期用药可挽救生命、控制发病；晚期用药可减少后遗症，迟至中毒后 5 ～ 7 日给药仍有一定效果。(3) 本品与 2% 盐酸普鲁卡因注射液混合注射，可减轻注射局部疼痛。(4) 如因用药而发生血尿可停药，应用糖皮质激素以减轻血尿。

【用法与用量】肌内注射。临用前，将本品 2.5 ～ 5.0 g 加 2% 盐酸普鲁卡因注射液 1 ～ 2 ml 混合后肌内注射。(1) 成人常用量：一次 2.5～5.0 g，一日 2～4 次；或按体重一日 0.1～0.3 g/kg，分 2 ～ 4 次肌内注射。疗程一般 5 ～ 7 日。严重中毒者，一次 5 ～ 10 g。(2) 小儿常用量：按体重一日 0.1 ～ 0.3 g/kg，分 2 ～ 4 次肌内注射，连用 5 ～ 7 日。

【制剂与规格】乙酰胺注射液：(1) 5 ml ∶ 2.5 g；(2) 10 ml ∶ 5 g。

维生素 K_1 [保（甲）]

Vitamin K_1

【适应证】用于抗凝血类灭鼠剂敌鼠钠、杀鼠灵等毒物的中毒。

【注意事项】(1) 严重的凝血酶原减少并发严重的出血时，维生素 K_1 的作用延迟，必须伍用凝血因子或新鲜血浆以迅速止血。(2) 大剂量注射本品时，可有暂时性抗维生素 K 作用，此时应重新使用抗凝药如肝素等。

【禁忌证】对本品过敏者禁用。

【不良反应】(1) 偶见过敏反应。少数人可出现皮疹。(2) 静注过快，超过一分钟 5 mg，可引起面部潮红、出汗、胸闷，严重时有支气管痉挛和血压下降。(3) 肌内注射可引起局部红肿和疼痛。

【用法与用量】肌内注射或静脉注射。用于静脉注射时，将本品 20 ～ 50 mg 用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释后缓慢注射，注射速度每分钟 4 ～ 5 mg。成人常用量：肌内注射，一次 10～20 mg，一日 2 ～ 3 次；严重中毒者，静脉注射，一次 40 ～ 60 mg，一日 100 ～ 300 mg，待出血倾向基本停止或凝血酶原时间恢复正常后改为肌内注射，直至停药。

【制剂与规格】维生素 K_1 注射液：1 ml ∶ 10 mg。

19.2.2.6 化学药物中毒解毒药

药物中毒的原因，不外乎误服或服药过量以及药物滥用等。药物品种多，不良反应发生率高，危害性大，鉴别诊断难度大，因此预防药物中毒更加重要。首先要严格依法管理药品，患者应按说明书和医嘱合理用药　遇有不良反应立即停药就医。以下介绍一些常用药品中毒的解毒药。

乙酰半胱氨酸 [保（乙）]

Acetylcysteine

【适应证】用于对乙酰氨基酚中毒。

【注意事项】(1) 严重支气管哮喘及糖尿病患者慎用。(2) 在中毒后 8 ～ 10 小时使用效果最好，超过 15 小时疗效降低，24 小时后可能无效。(3) 与铁、铜等金属、橡胶、氧气接触时间较长易失效。

【不良反应】(1) 口服偶见恶心、呕吐，罕见皮疹和支气管痉挛等过敏反应。(2) 静脉注射和过量可引起血管扩张、皮肤潮红、恶心、呕吐、支气管痉挛和水肿、心动过速及血压降低。

【用法与用量】口服或静脉滴注。(1) 口服：①成人常用量，首次按体重140 mg/kg，以后按体重一次70 mg/kg，每4小时一次，共17次；②小儿常用量，同成人常用量，按体重给药。(2) 静脉滴注：①成人常用量，第1阶段，按体重150 mg/kg，加入5%葡萄糖注射液200 ml中静脉滴注15～20分钟；第2阶段，按体重50 mg/kg，加入5%葡萄糖注射液500 ml中静脉滴注4小时；第3阶段，按体重100 mg/kg，加入5%葡萄糖注射液1 000 ml中静脉滴注16小时(严重者可持续静脉滴注)。②小儿常用量，同成人常用量，按体重给药。

【制剂与规格】乙酰半胱氨酸颗粒剂：① 100 mg；② 200 mg。

乙酰半胱氨酸泡腾片：600 mg。

乙酰半胱氨酸胶囊：200 mg。

乙酰半胱氨酸注射液：20 ml ：4 g。

纳洛酮[保(甲)]

Naloxone

【适应证】用于阿片类药物、镇静催眠药及急性酒精中毒。

【不良反应】(1) 偶见口干、恶心、呕吐、食欲缺乏、困倦或烦躁不安、血压升高和心率加快，大多数不用处理自行恢复。(2) 个别患者可能诱发心律失常、肺水肿和心肌梗死。

【注意事项】(1) 高血压和心功能不全患者慎用。(2) 密切观察生命体征的变化，如呼吸、心律和心率、血压等，如有变化应及时采取相应措施。(3) 阿片类及其他麻醉性镇痛剂成瘾者，当注射本品时将会立即出现戒断症状，遇此情况时要注意掌握剂量。

【用法与用量】静脉注射。临用前，将本品0.4～0.8 mg用灭菌注射用水或5%葡萄糖注射液10～20 ml溶解(稀释)后静脉注射，注射时间4～5分钟。(1) 成人常用量：一次0.4～0.8 mg，必要时2～3分钟重复1次，须根据病情重复用药以巩固疗效。(2) 小儿常用量：同成人。

【制剂与规格】盐酸纳洛酮注射液：1 ml ：0.4 mg。

注射用盐酸纳洛酮：① 0.4 mg；② 0.8 mg；③ 1.2 mg；④ 2 mg。

烯丙吗啡[保(甲)]

Nalorphine

【适应证】主要用于阿片受体激动药急性中毒的解救。适用于吗啡、哌替啶等镇痛药过量中毒。

【注意事项】临床上不将其用于镇痛。本品对喷他佐辛(镇痛新)和其他阿片受体激动－拮抗药引起的呼吸抑制无拮抗作用，对巴比妥类或其他全身麻醉药引起的呼吸抑制也无拮抗作用，如果使用，反而使呼吸抑制明显加重。近年来已被纳洛酮取代。

【不良反应】大剂量可产生发音困难、缩瞳、倦怠和发汗等。

【用法与用量】皮下注射或静脉注射：成人常用量一次5～10 mg，极量一日40 mg。

【制剂与规格】氢溴酸烯丙吗啡注射液：1 ml ：10 mg。

阿扑吗啡[保(甲)]

Apomorphine

【适应证】主要用于抢救意外中毒及不能洗胃的患者，常用于治疗石油蒸馏液吸入患者，如煤油、汽油、煤焦油、燃料油或清洁液等，以防止严重的吸入性肺炎。

【注意事项】(1) 皮下注射5～10分钟后先出现恶心、面色苍白、继而发生呕吐。(2) 对吗啡及其衍生物过敏的患者，对阿扑吗啡也常可过敏。(3) 对麻醉药物中毒的患者，由于中枢已被抑制，本品常难奏效，甚至可能加重其抑制作用，故不适用。(4) 为提高疗效，注药前应先饮水，成人250 ml。(5) 给药过程中可出现血清催乳素浓度降低。(6) 阿扑吗啡遇光易变质，变为绿色者即不能使用。(7) 妊娠、哺乳期妇女用药尚不明确，幼儿、老年衰弱患者对阿扑吗啡的易感性增高，均应慎

用。(8)用药时应监测患者的心血管功能。

【禁忌证】下列情况禁用：心力衰竭或心力衰竭先兆，腐蚀性中毒，张口反射抑制，醉酒状态明显，已有昏迷或有严重呼吸抑制，阿片、巴比妥类或其他中枢神经抑制药所导致的麻痹状态，癫痫发作先兆，休克前期，士的宁中毒，昏迷或严重呼吸抑制，开放性肺结核，胃及十二指肠溃疡，中枢神经系统器质性病变等患者。

【不良反应】(1) 本品可刺激又可抑制中枢神经系统，可出现呼吸抑制、呼吸急促、急性循环衰竭、昏迷，甚至死亡。(2) 用量过大可引起持续性呕吐。(3) 昏睡、晕厥和直立性低血压等。(4) 快速或不规则的呼吸、疲倦无力、颤抖或心率加快，以及中枢神经刺激反应。(5) 皮下注射可出现瘙痒、红色结节等局部反应。

【用法与用量】皮下注射：成人一次 2 ~ 5 mg，一次极量 5 mg；小儿按体重 0.07 ~ 0.1 mg/kg；极量一次 5 mg。不得重复使用。

【制剂与规格】盐酸阿扑吗啡注射液：1 ml ： 5 mg。

纳美芬[保（乙）]

Nalmefene

【适应证】本品主要用于阿片类药物过量或中毒的急救，也用于手术后的麻醉催醒、酒精中毒的急救、戒毒后防复吸、休克的辅助治疗及酒精依赖的辅助治疗等，是阿片受体拮抗剂纳络酮和纳曲酮的理想替代品。

【注意事项】对与阿片样物质无关的镇静及低血压的病例，本品不产生作用。因此，只有根据患者使用阿片样物质过量的历史或呼吸抑制并伴随瞳孔收缩的临床特征来判断在阿片样物质过量的可能性较高情况下，才可以给患者使用本品进行治疗。

【用法与用量】(1) 用于术后阿片样物质抑制：静脉注射，使用 1 ml ：0.1 mg 规格的制剂。初始剂量按体重 0.25 μg/kg，2 ~ 5 分钟后再给 0.25 μg/kg 补充，呈现阿片逆转作用后立即停止给药。累计剂量超过 1 μg/kg 不会增加治疗效应。在已知可能增加患者心血管危险的情况下，可将本品用氯化钠注射液或灭菌注射用水进行 1 ： 1 稀释，并使用 0.1 μg/ml 这样较小的初始及补充剂量。(2) 用于已知或怀疑使用阿片样物质过量：静脉注射，使用 2 ml ： 2 mg 规格的制剂。初始剂量按体重 0.5 mg/70 kg，如有必要，2 ~ 5 分钟后给予第 2 个剂量。如总剂量达到 1.5 mg/70 kg 仍无临床作用，则增加剂量也不会起作用。当呼吸频率达到正常情况后，就应停止给药，以尽可能减少发生心血管危险与催促戒断综合征的概率。

【制剂与规格】盐酸纳美芬注射液：① 1 ml ： 0.1 mg（蓝色标签，用于术后呼吸抑制等）；② 2 ml ： 2.0 mg（绿色标签，用于阿片类药物中毒的救治）。

氟马西尼[保（甲）]

Flumazenil

【适应证】用于苯二氮䓬类药物中毒，作为苯二氮䓬类药物过量时中枢镇静作用的特效逆转药。

【注意事项】(1)混合性药物中毒慎用。(2) 哺乳期妇女慎用。(3) 对于 1 周内大剂量使用过苯二氮䓬类药物者，以及（或）较长时间使用苯二氮䓬类药物者，应避免快速静脉注射本品。如快速静脉注射本品可出现戒断症状，如兴奋、焦虑、心悸、恐惧、情绪不稳、轻微混乱和感觉失真等，故应缓慢注射。如出现严重戒断症状，应静脉注射地西泮 5 mg 或咪达唑仑 5 mg。

【禁忌证】(1) 对本品过敏的患者禁用。(2) 妊娠早期妇女禁用。(3) 麻醉后肌松剂作用未消失的患者禁用。

【不良反应】可见面部潮红、恶心、呕吐，快速注射后可见焦虑、心悸、恐惧。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注。用于静脉注射时，将本品 0.5 ~ 1 mg 用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 10 ml 稀释后缓慢静脉注射，注射时间 1 ~ 3 分钟；用于静脉滴注时，将本品 1~2 mg 用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 100~200 ml 稀释后缓慢静脉滴注，滴注时间 2~5 小时。(1) 成人常用量：0.5~2 mg，静脉注射或静脉滴注。首次 0.2 mg，静脉注射。如 1 分钟内未达到要求的清醒程度，可以重复给药。重复给药一次增加

0.1 mg，或以每小时 0.1 ~ 0.4 mg 速度静脉滴注，直至患者清醒为止。一般最大剂量 0.5 mg，但大剂量苯二氮䓬类药物中毒者可用至 1 ~ 2 mg 或以上。(2) 小儿常用量：按体重 0.01 mg/kg，最大剂量 1 mg。

【制剂与规格】氟马西尼注射液：① 5 ml ：0.5 mg；② 10 ml ：1 mg。

贝美格 [保(甲)]

Bemegride

【适应证】用于巴比妥类及其他催眠药的中毒，也用于减少硫喷妥钠麻醉深度，以加快其苏醒。

【注意事项】(1) 急性血卟啉症慎用，因可能诱发急性发作。(2) 如用量太大或静脉滴注速度太快，可引起恶心、呕吐、腱反射亢进、低血压、肌肉抽搐甚至惊厥，可静脉注射地西泮或硫喷妥钠加以控制。

【不良反应】(1) 静脉滴注速度如太快，可引起肌肉抽搐甚至惊厥。(2) 迟发毒性，表现为情绪不安、精神错乱、幻视等。

【用法与用量】静脉滴注。将本品 50 mg 用 5% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 稀释后静脉滴注，3 ~ 5 分钟滴完，视病情可重复给药。

【制剂与规格】贝美格注射液：① 10 ml ：50 mg；② 20 ml ：50 mg。

甲硫氨酸维 B_1 [保(乙)]

Methionine and Vitamin B_1

【适应证】本品用于改善肝脏功能，对肝脏疾病，如急慢性肝炎、肝硬化，尤其是对脂肪肝有较明显的疗效，能改善肝内胆汁淤积；可用于酒精、巴比妥类、磺胺类药物中毒时的辅助治疗。

【注意事项】(1) 对有血氨增高的肝硬化前及肝硬化病人应注意监测血氨水平。(2) 孕妇及哺乳期妇女用药的安全性尚不明确。(3) 尚无儿童用药的经验。(4) 老年患者用药的安全性尚不明确。

【禁忌证】(1) 对甲硫氨酸及维生素 B_1 过敏的患者禁用。(2)肝昏迷患者禁用。

【不良反应】静脉滴注时偶有恶心、头痛。

【用法与用量】(1) 肌内注射：一次 40 ~ 100 mg（以甲硫氨酸计），一日 1 ~ 2 次。(2) 静脉滴注：一次 100 ~ 200 mg（以甲硫氨酸计），一日 1 次。临用前用氯化钠注射液或 5% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 稀释后使用。

【制剂与规格】甲硫氨酸维 B_1 注射液：① 2 ml ：甲硫氨酸 40 mg 与维生素 B_1 4 mg；② 5 ml ：甲硫氨酸 100 mg 与维生素 B_1 10mg。

注射用甲硫氨酸维 B_1：① 甲硫氨酸 40 mg 与维生素 B_1 4 mg；② 甲硫氨酸 100 mg 与维生素 B_1 10 mg。

亚叶酸钙 [保(乙)]

Calcium Folinate

【适应证】(1) 用于甲氨蝶呤、乙胺嘧啶或甲氧苄啶等抗叶酸代谢药过量中毒。(2) 用于甲醇中毒的辅助治疗。

【注意事项】(1) 亚叶酸制剂含有防腐剂，偶可致变态反应。(2) 本品不宜与甲氨蝶呤同时使用，以免影响后者的抗叶酸作用，一次大剂量应用甲氨蝶呤 24 ~ 48 小时后再应用本品，使甲氨蝶呤的血药浓度不低于其治疗浓度。

【不良反应】(1) 静脉注射容易发生不良反应，但肾功能正常者很少发生中毒。(2) 长期应用偶见食欲缺乏、腹胀、恶心等。(3) 偶见过敏反应，可出现皮疹和支气管痉挛，甚至诱发癫痫。(4) 大量服用尿液呈黄色。

【用法与用量】口服、肌内注射或静脉注射。用于肌内注射时，将本品 3 ~ 25 mg 用灭菌注射用水或 5%葡萄糖注射液 2 ~ 4 ml 溶解后使用；用于静脉注射时，将本品 200 ~ 250 mg 用 5%葡萄糖注射液 20 ml 溶解后注射，注射时间 4 ~ 5 分钟。(1) 抗叶酸代谢药过量中毒：首次使用相当于抗叶酸代谢药的剂量，即 15 ~ 100 mg，静脉注射。以后，如为甲氨蝶呤过量中毒，一次 15 mg，注射给药或口服，每 3 ~ 6 小时 1 次，共 8 次；如为甲氧苄啶过量中毒，一次 5 mg，口服，一日 1 次，共 5 ~ 7 日。(2) 甲醇中毒：一次 50 mg，静脉注射，4 小时 1 次，共 2 日。

【制剂与规格】亚叶酸钙片：15 mg。

亚叶酸钙注射液：① 1 ml ：3 mg；

② 1 ml ∶ 5 mg；③ 3 ml ∶ 30 mg；④ 5 ml ∶ 50 mg；⑤ 10 ml ∶ 100 mg。

注射用亚叶酸钙：① 3 mg；② 5 mg；③ 25 mg；④ 30 mg；⑤ 50 mg；⑥ 100 mg。

维生素 B_6 [保(甲)]

Vitamin B_6

【适应证】用于异烟肼、偏二甲基肼等肼类化合物中毒。

【注意事项】(1) 超大剂量应用维生素 B_6 可引起外周神经病变，出现感觉异常、肌无力、肢体运动障碍等，多发生在一日总量超过 15 g 以上者，剂量越大发病率越高。(2) 异烟肼等中毒时，应建立静脉通道药物解毒，尽早应用维生素 B_6，剂量相当于摄入异烟肼的总量。

【用法与用量】静脉注射或静脉滴注。用于静脉注射时，临用前，将本品 50 ~ 300 mg 用 5% 葡萄糖注射液 20 ~ 40 ml 溶解（稀释）后注射，注射时间 4 ~ 6 分钟；用于静脉滴注时，临用前，将本品 1 000 mg 用 5% 葡萄糖注射液或 10% 葡萄糖注射液 250 ~ 500 ml 溶解（稀释）后滴注，滴注时间 2 ~ 3 小时。(1) 成人常用量：①异烟肼中毒，首剂按摄入异烟肼的总量的 1/2 或 1/3，缓慢静脉注射或静脉滴注，随后分次重复使用，根据病情可重复使用到与所摄入的异烟肼同量，直至癫痫样症状完全控制；②偏二甲基肼中毒，首剂 1 ~ 5 g，缓慢静脉注射，随后静脉滴注 1 ~ 5 g 至惊厥停止，一日总量不宜超过 10 g。(2) 小儿常用量：参照成人用量与用法。

【制剂与规格】维生素 B_6 注射液：① 1 ml∶25 mg；② 1 ml∶50 mg；③ 1 ml∶100 mg。

19.2.2.7 蛇毒中毒解毒药

蛇毒中毒即当毒蛇咬伤人体时，其毒液由沟牙或管牙注入人体，通过血液循环，分布至全身而引起各种不同的局部和全身中毒症状。最常见的蛇毒可分为 3 类：一是神经毒素，如金环蛇、银环蛇；二是血循毒素，如竹叶青蛇、尖吻蝮蛇；还有一种是混合毒素类，既含有神经毒素，又含有血循毒素，如眼镜蛇、蝮蛇等。神经毒素使患者出现头昏、眼花、肌肉关节疼痛、吞咽困难、颈项强直、抽搐、呼吸肌麻痹等症状，最后窒息而死亡。血循毒素则引起溶血、出血、血管内皮细胞破损，并对心肌产生损害，引起心肌炎、心力衰竭而死亡。毒蛇咬伤后现场急救很重要，应采取各种措施，迅速排出毒液并防止毒液的吸收与扩散。到达有条件的医疗站后，应继续采取综合措施，如彻底清创，内服及外敷有效的蛇药片，注射抗蛇毒血清及全身的支持疗法。

抗蛇毒血清是专供治疗毒蛇咬伤的特效药物，它可中和相应的蛇毒，是一种特异性被动免疫反应。抗蛇毒血清有单价与多价两类，单价抗蛇毒血清特异性强，效价高，疗效好；多价抗蛇毒血清特异性小，效价低，疗效差，患者应在 30 分钟内使用最好。我国现生产抗蝮蛇毒血清、抗五步蛇毒血清、抗银环蛇毒血清及抗眼镜蛇毒血清。抗五步蛇毒血清也适用于烙铁头蛇、竹叶青蛇、蝮蛇等咬伤的治疗。这些血清均能特异治疗相应的蛇种咬伤所致的毒素中毒；在鉴别蛇伤的蛇种后，尽快使用特异的抗蛇毒血清。抗蛇毒血清注射后可迅速起效，血压逐步升高，神志逐渐清醒，30 分钟至数小时后神经症状和出血有好转。半衰期 ($t_{1/2}$) 为 26 ~ 95 小时，因此抗蛇毒血清需连用 3 ~ 4 天。

抗蛇毒血清的不良反应包括过敏性休克和血清病。①过敏性休克可在注射中或注射后数分钟至数十分钟内突然发生。患者突然表现沉郁或烦躁、脸色苍白或潮红、胸闷或气喘、出冷汗、恶心或腹痛、脉搏细速、血压下降、重者神志昏迷虚脱，如不及时抢救可以迅速死亡。轻者注射肾上腺素后即可缓解；重者需输液输氧，使用升压药维持血压，并使用抗过敏药物及肾上腺皮质激素等进行抢救。②血清病主要症状为荨麻疹、发热、淋巴结肿大、局部浮肿，偶有蛋白尿、呕吐、关节痛，注射部位可出现红斑、瘙痒及水肿。一般系在注射后 7 ~ 14 日发病，称为延缓型。亦有在注射后 2 ~ 4 日发病，称为加速型。对血清病应对症疗法，可使用钙剂或抗组织胺药物，一般数日至十数日即可痊愈。

抗蛇毒血清使用注意事项：①使用

抗蛇毒血清须特别注意防止过敏反应。注射前必须先做过敏试验并详细询问既往过敏史。凡过敏试验为阳性反应者慎用。②对蛇咬伤者，应同时注射破伤风抗毒素1 500 ~ 3 000 U。③门诊病人注射抗蛇毒血清后，需观察至少30分钟方可离开。

抗蝮蛇毒血清[保(甲)]

Agkistrodon Halys Antivenin

本品系用蝮蛇毒素免疫的马血浆，经酶消化、盐析制成。

【适应证】用于蝮蛇、竹叶青蛇、龟壳花蛇等蝮蛇科毒蛇咬伤。

【用法与用量】静脉注射。临用前，将本品6 000 ~ 1 200 U用氯化钠注射液或25%葡萄糖注射液20 ~ 40 ml稀释后缓慢静脉注射，注射速度每分钟4 ml。(1) 成人常用量：一次6 000 ~ 12 000U。(2) 儿童常用量：一次6 000 ~ 12 000U。

【制剂与规格】抗蝮蛇毒血清注射液：10 ml ∶ 6 000 U。

抗五步蛇毒血清[保(甲)]

Agkistrodon Acutus Antivenin

本品系用五步蛇毒素免疫的马血浆，经酶消化、盐析制成。

【适应证】用于五步蛇及蝮蛇科的其他毒蛇咬伤。

【用法与用量】静脉注射。临用前，将本品4 000 ~ 8 000 U用氯化钠注射液40 ~ 80 ml稀释后缓慢静脉注射，注射速度每分钟4 ml。(1) 成人常用量：一次4 000 ~ 8 000 U。(2) 儿童常用量：一次4 000 ~ 8 000 U。

【制剂与规格】抗五步蛇毒血清注射液：10 ml ∶ 2 000 U。

抗银环蛇毒血清[保(甲)]

Bungarus Multicinctus Antivenin

本品系用银环蛇毒素免疫的马血浆，经酶消化、盐析制成。

【适应证】用于银环蛇咬伤。

【用法与用量】静脉注射。临用前，将本品10 000U用氯化钠注射液20 ~ 40 ml稀释后缓慢静脉注射。(1) 成人常用量：一次10 000 U。(2) 儿童常用量：一次10 000 U。

【制剂与规格】抗银环蛇毒血清注射液：2 ml ∶ 10 000 U。

抗眼镜蛇毒血清

Naja Naja (atra) Snake Antivenin

本品系由眼镜蛇毒或脱毒眼镜蛇毒免疫马所得的血浆，经胃酶消化后纯化制成的冻干抗眼镜蛇毒球蛋白制剂。

【适应证】用于眼镜蛇咬伤。

【用法与用量】缓慢静脉注射。(1) 成人常用量：一次2 500 ~ 10 000 U。(2) 儿童常用量：一次2 500 ~ 10 000 U。

【制剂与规格】抗眼镜蛇毒血清注射液：① 10 ml ∶ 2 500 U；② 10 ml ∶ 10 000 U。

19.2.2.8 肉毒中毒解毒药

肉毒抗毒素[保(甲)]

Botulinum Antitoxin

【适应证】用于预防及治疗肉毒中毒。凡已出现肉毒中毒症状者，应尽快使用本抗毒素进行治疗。对可疑中毒者亦应尽早使用本抗毒素进行预防。在一般情况下，人的肉毒中毒多为A型、B型、或E型，中毒的毒素型别尚未得到确定之前，可同时使用2个型，甚至3个型的抗毒素。

【不良反应】(1) 过敏性休克。(2) 血清病，主要症状为荨麻疹、发热、淋巴结肿大、局部浮肿，偶有蛋白尿、呕吐、关节痛，注射部位可出现红斑、瘙痒及水肿。一般系在注射后7 ~ 14日发病，称为延缓型。亦有在注射后2 ~ 4日发病，称为加速型。对血清病应对症疗法，可使用钙剂或抗组胺药物，一般数日至十数日即可痊愈。

【禁忌证】过敏试验为阳性反应者慎用，详见脱敏注射法。

【注意事项】(1) 本品为液体制品。制品混浊、有摇不散的沉淀、异物或安瓿有裂纹、标签不清，过期失效者均不能使用。安瓿打开后应一次用完。(2) 每次注射须保存详细记录，包括姓名、性别、年龄、住址、注射次数、上次注射后的反应情况、本次过敏试验结果及注射后反应情

况、所用抗毒素的生产单位名称及批号等。(3) 注射用具及注射部位应严格消毒。注射器宜专用，如不能专用，用后应彻底洗净处理，最好干烤或高压蒸汽灭菌。同时注射类毒素时，注射器须分开。(4) 使用抗毒素须特别注意防止过敏反应。注射前必须做过敏试验并详细询问既往过敏史。凡本人及其直系亲属曾有支气管哮喘、枯草热、湿疹或血管神经性水肿等病史，或对某种物质过敏，或本人过去曾注射马血清制剂者，均须特别提防过敏反应的发生。(5) 过敏试验：用氯化钠注射液将抗毒素稀释 10 倍（0.1 ml 抗毒素加 0.9 ml 氯化钠注射液），在前掌侧皮内注射 0.05 ml，观察 30 分钟。注射部位无明显反应者，即为阴性，可在严密观察下直接注射抗毒素。如注射部位出现皮丘增大、红肿、浸润，特别是形似伪足或有痒感者，为阳性反应，必须用脱敏进行注射。如注射局部反应特别严重或伴有全身症状，如荨麻疹、鼻咽刺痒、喷嚏等，则为强阳性反应，应避免使用抗毒素。如必须使用时，则应采用脱敏注射，并做好抢救准备，一旦发生过敏休克，立即抢救。无过敏史者或过敏反应阴性者，也并非没有发生过敏休克的可能。为慎重起见，可先注射小量于皮下进行试验，观察 30 分钟，无异常反应，再将全量注射于皮下或肌内。(6) 脱敏注射法：在一般情况下，可用氯化钠注射液将抗毒素稀释 10 倍，分小量数次做皮下注射，每次注射后观察 30 分钟。第 1 次可注射 10 倍稀释的抗毒素 0.2 ml，观察无发绀、气喘或显著呼吸短促、脉搏加速时，即可注射第 2 次 0.4 ml，如仍无反应则可注射第 3 次 0.8 ml，如仍无反应即可将安瓿中未稀释的抗毒素全量做皮下或肌内注射。有过敏史或过敏试验强阳性者，应将第 1 次注射量和以后的递增量适当减少，分多次注射，以免发生剧烈反应。(7) 门诊病人注射抗毒素后，须观察 30 分钟方可离开。

【用法与用量】皮下注射，应在上臂三角肌附着处。同时注射类毒素时，注射部位须分开。肌内注射应在上臂三角肌中部或臀大肌外上部。只有经过皮下或肌内注射未发生异常反应者方可做静脉注射。静脉注射应缓慢，开始每分钟不超过 1 ml，以后每分钟不宜超过 4 ml。一次静脉注射不应超过 40 ml，儿童按体重不应超过 0.8 ml/kg，亦可将抗毒素加入葡萄糖注射液、氯化钠注射液等输液中静脉滴注。静脉注射前将安瓿在温水中加热至接近体温，注射中发生异常反应，应立即停止。(1) 预防：1 次皮下注射或肌内注射 1 000 ~ 20 000 U（指 1 个型）。若情况紧急，亦可酌情增量或采用静脉注射。(2) 治疗：采用肌内注射或静脉滴注。第 1 次注射 10 000 ~ 20 000 U（指 1 个型），以后视病情决定，可每隔约 12 小时注射 1 次。只要病情开始好转或停止发展，即可酌情减量（例如减半）或延长间隔时间。

【制剂与规格】肉毒抗毒素注射液：① 10 000U（单价 A 型）；② 5 000 U（单价 B 型）；③ 5 000U（单价 E 型）。

第20章 诊断用药

诊断用药(diagnostic agent)是用于疾病和症状诊断过程应用的药物，包括诊断用生物制品和放射诊断用药(对比剂)。前者是用于检测相应的抗原、抗体或机体免疫状态的制品，包括毒素、诊断血清、分群血清、分型血清、因子血清、诊断菌液、抗原或抗体致敏血细胞、免疫扩散板等；后者为放射诊断需用的各种对比剂，包括离子型对比剂、低离子型对比剂、非离子型对比剂和其他对比剂。

对比剂(contrast media)又称造影剂，是为增强影响观察效果而注入(或服用)到人体组织或器官的化学制品。对比剂的密度高于或低于周围组织，形成的对比用某些器械显示图像，为疾病的诊断提供重要的依据。如X线、CT、超声造影、磁共振等观察常用的碘制剂、钆制剂、硫酸钡等。对比剂是介入放射学操作中最常使用的药物之一，主要用于血管、体腔的显示。对比剂种类多样，本章主要介绍介入放射学的对比剂，多为含碘制剂。

20.1 对比剂的分类

对比剂可分为两类，即原子量高、比重大的高密度对比剂和原子量低、比重小的低密度对比剂。常用的高密度对比剂有硫酸钡和碘制剂。近年来，又有用于磁共振成像的钆制剂上市应用。

(1) 硫酸钡：一般用于消化道造影检查，由纯净的医用硫酸钡粉末加水调制成混悬液。硫酸钡的浓度通常以重量/体积表示，根据检查的部位和目的不同，所用硫酸钡的浓度也不同。

(2) 碘制剂：碘制剂的种类很多，可分为3大类，即无机碘化物、有机碘化物以及碘化油或脂肪酸碘化物。有机碘化物亦为水溶性碘制刑，种类繁多，又分为离子型、非离子型、非离子型二聚体、碘化油或脂肪酸碘化物。近期又有含钆的对比制剂应用。

对比剂还可按药物的渗透压分类，即高渗、低渗和等渗3种。等渗的药物机体耐受性好，过高过低均有不同程度的刺激反应。

20.2 对比剂的不良反应

对比剂反应可分为特异质反应及物理-化学反应，前者与剂量无关，而后者则与剂量有明确的关系。

20.2.1 特异质反应

对比剂所致不良反应中的荨麻疹、血管性水肿、喉头水肿、支气管痉挛、严重血压下降及突然死亡等表现均属特异质反应，其发生与下列因素有关。

(1) 细胞释放介质：无论是离子型还是非离子型对比剂均能刺激肥大细胞释放组胺。通过测定尿液中组胺或其代谢物发现有对比剂反应患者含量明显高于无对比剂反应者。

(2) 抗原抗体反应：对比剂是一种半抗原，其造影分子中的某些基团能与血清中的蛋白结合成为完整抗原。有许多研究结果证实对比剂反应中有部分是抗原抗体反应。

(3) 激活系统：对比剂尤其是离子型高渗对比剂可导致血细胞及内皮细胞形态和功能改变，并可导致组胺、5-羟色胺、缓激肽、血小板激活因子等介质的释放。

(4) 胆碱能作用：对比剂能通过抑制乙酰胆碱活性产生胆碱能样作用，许多类型的碘对比剂均有类似作用，所以此作用被认为主要是碘本身在起作用。

20.2.2 物理-化学反应

物理-化学反应的发生率及严重程度与所用对比剂的量有关，对比剂反应中常见的恶心、呕吐、潮红、发热及局部疼痛等均由此所致，其有关因素如下。

20.2.2.1 渗透压

由于目前常用对比剂的渗透压均明显超过血液，是血液的 2 ~ 5 倍，极易产生损害。

(1) 内皮和血脑屏障损害：高渗的对比剂注入血管后，细胞外液渗透压急剧增加，细胞内液快速排出，导致血管内皮细胞皱缩，细胞间连接变得松散、断裂，使血脑屏障受损；对比剂外渗至脑组织间隙，使神经细胞暴露在对比剂的化学毒性危险中。

(2) 红细胞损害：高渗使得红细胞变硬，呈棘细胞畸形，结果红细胞不易或无法通过毛细血管，引起微循环紊乱。

(3) 高血容量：除细胞内液排出外，高渗对比剂可使组织间液进入毛细血管，从而使血容量快速增加，可达 10% ~ 15%，导致心脏负荷增加。但不久，随对比剂外渗至血管外及渗透性利尿作用，血容量很快恢复正常。

(4) 肾毒性：虽然对比剂诱发肾衰竭的发生率较低（< 1%）。但在原有肾功能不全患者中可达 10% ~ 20%，60% 对比剂诱发的肾病患者有氮质血症基础。

(5) 心脏毒性：除了对比剂所致的高血容量外，在选择性冠状动脉对比中，高渗透性可直接作用于窦房结引起心动过缓。高渗透性能使房室间传导、室内传导和复极化作用减弱，引起心电改变，使心律不齐和心室颤动的发生率增加。

(6) 疼痛与血管扩张：在外周血管造影中，虽然高渗对比剂所致内皮损害是一过性的，但产生的血管性疼痛却是非常明显的。除了和渗透压有关外，也和对比剂的疏水性及离子性有关。对比剂可直接作用于小动脉平滑肌，引起局部动脉扩张，产生热感及不适。

20.2.2.2 水溶性

对比剂只有和周围的液体充分混合，才不会被视为异物。理想的对比剂应具有无限的水溶性，但由于碘原子具有高度疏水性，因此难以达到无限的水溶性。离子型对比剂中的水溶性来自阳离子的盐，而非离子型对比剂中的水溶性则来自分子核心并减少它与生物大分子的结合，以降低对比剂的生物活性，减少反应。单体的离子型对比剂水溶性比非离子型高，但非离子型二聚体对比剂碘曲仑却具有极高的水溶性。

20.2.2.3 电荷

离子型对比剂是由具有造影作用的含碘根阴离子及不具有造影功能的阳离子组成，前者带有负电荷，而后者则带正电荷。电荷可增加体液的传导性，扰乱电离环境和电解质平衡，进而影响正常生理过程。对比剂的电荷对其水溶性及疏水性起着较大的作用，并可增加对比剂与蛋白的结合。

20.2.2.4 黏稠度

黏稠度由溶质颗粒的浓度、形状、与溶液的作用及溶质颗粒之间的作用所决定，与温度变化成反比，但与碘浓度成正比，如 300 mg（I）/ml 37℃时碘曲仑的黏稠度为 9.1 cps，碘海醇为 6.1 cps，但碘曲仑 280 mg（I）/ml 时其黏稠度与非离子型单体对比剂碘海醇 300 mg（I）/ml 相似。注入对比剂后可使血液-对比剂混合物黏稠度增加，从而可使血流减慢。这种情况只有在高切变力状态（如大动脉）及低切变力状态（静脉和毛细血管循环）

才有可能出现，但对提高显影清晰度却有利。为此，尽管非离子型二聚体对比剂与单体类对比剂相比黏稠度较高，但综合其显影效果及反应而言，前者是后者所无法比拟的。

20.2.2.5 化学毒性

化学毒性是由对比剂分子中疏水区与生物大分子结合，影响其正常功能，即所谓的“疏水效应”。第一代非离子型对比剂甲泛葡胺由于大量引入疏水基团且又未能遮掩，故化学毒性很大。此后的非离子型对比剂中亲水基团能有效地遮盖疏水核心，因而毒性明显降低。

20.3 对比剂风险的高危因素

（1）有对比剂过敏史者。

（2）过敏体质者（如湿疹、荨麻疹、神经性皮炎、哮喘、食物及花粉过敏者）。

（3）有原发疾病：包括甲状腺功能亢进、甲状腺肿、严重心血管病患（心功能不全、冠状动脉硬化、近期心肌梗死、长期心律失常和高血压等）、体弱、脱水、严重肝肾疾病、严重糖尿病、严重肺部疾患（呼吸功能不全、肺动脉高压症和肺栓塞等）、脑损伤（新近脑血管损伤、惊厥、颅脑外伤）、副蛋白血症（巨球蛋白血症、浆细胞瘤等）、嗜铬细胞瘤（有高血压危象）、镰状细胞贫血者。

（4）特殊人群：65岁以上老年人、婴幼儿、过度焦虑者、近期应用过对比剂者。

（5）长期用药：长期应用钙通道阻滞药、β受体拮抗药（易引起支气管痉挛及可能发生难以治疗的心动过缓）、应用白介素-2或干扰素治疗、使用双胍类降糖药者（易致肾功能不全、乳酸性血症）。

20.4 对比剂不良反应的预防

20.4.1 正确对待对比剂“过敏试验”

随着非离子型对比剂的广泛使用，以离子型对比剂的试验结果来判断非离子型对比剂可能出现的反应显然是不合理的。由于对比剂反应尤其是重度反应常和剂量无关，1 ml的试验剂量就可能产生致命的特异质反应。此外，临床上因对判断标准的理解程度不同，该试验的假阳性率及假阴性率均很高。为此，国外主要放射学会和大多数医院均不做这种“过敏试验”，有的则仅限于过敏史的患者，但我国卫生部门仍未放弃该试验。

20.4.2 对高危患者采取预防措施

20.4.2.1 预防用药

(1) 使用低量非离子型对比剂。(2) 预先使用抗过敏药：氯苯那敏2～4 mg，在使用对比剂前10～15分钟缓慢静脉注射；或西咪替丁200～400 mg缓慢静脉注射或加入0.9%的氯化钠溶液50 ml静脉滴注。(3) 预先给予糖皮质激素：口服甲泼尼龙，于应用对比剂前24小时、12小时分别服用40 mg；或给予泼尼松龙或甲泼尼龙250 mg，于使用对比剂前30分钟静脉注射。(4) 稳定心血管系统。(5) 维持水、电解质及酸碱平衡。(6) 避免联合应用有肾毒性药（非甾体抗炎药、两性霉素B、顺铂、氨基糖苷及头孢菌素类抗生素、二甲双胍等）。(7) 为维持甲状腺素功能的自律性，于造影前及造影后2小时分别使用40及20滴氯酸钠，造影后1周内一日3次，一次15滴。(8) 甲状腺功能亢进患者只有在非常必要情况下可使用X线对比剂，且需每日增加使用甲巯咪唑20 mg，维持1～2周。

20.4.2.2 减少对比剂用量

对比剂反应中的物理-化学反应与所用对比剂的量有明确的线性正比关系，减少不必要的用量可减少或减轻对比剂反应。为此，在每次造影术前应尽量避免出现因技术操作因素所导致的造影失败或重复造影现象。当然，如造影所需，则应重复或再次造影，也有人采用几日后再造影的方法。对于疑难患者的选择性血管造影，有时先做非选择性造影明确血管的走行后再做选择性插管，反而可减少对比剂量及X线量。

20.4.2.3 注意注射方式

不同的注射方式其对比剂反应的发生

率也不同，应严格掌握不同造影检查的不同注射技术，以免增加发生率。

20.5 常用的对比剂

硫酸钡[保(甲)]

Barium Sulfate

【适应证】食管、胃、十二指肠、小肠、结肠的单、双对比造影检查；也可用于消化道双对比检查。

【注意事项】(1) 硫酸钡必须严格按药典规定检查，不得含有可溶性钡盐。(2) 下列情况慎用本品作口服胃肠道检查：①急性胃、十二指肠出血；②小肠梗阻；③习惯性便秘。(3) 下列情况慎用本品作结肠灌肠检查：①结肠梗阻；②习惯性便秘；②巨结肠；④重症溃疡性结肠炎；⑤结肠套叠。(4) 做过结肠活体病理检查后1～2周方可进行钡剂灌肠，以免发生结肠穿孔。(5) 做过结肠活体病理检查后1～2周方可进行钡剂灌肠，以免发生结肠穿孔。(6) 老年患者慎用本品作钡灌肠。

【禁忌证】下列情况禁用本品作口服胃肠道检查：急性胃肠穿孔、食管气管瘘和疑先天性食管闭锁、近期内食管静脉破裂大出血、结肠梗阻、咽麻痹。

【不良反应】口服钡剂可引起恶心、便秘、腹泻等症状；使用不当也可发生肠穿孔，继而发生腹膜炎、粘连、肉芽肿，严重者也可致死。钡剂大量进入肺后，可造成机械刺激和炎症反应，早期引起异物巨细胞、上皮样细胞和单核细胞浸润，以后在沉积的钡炎周围发生纤维化，形成钡结节。

【用法与用量】通常采用的引入方式有口服、小肠灌肠和结肠灌肠等。(1) 食管检查：口服钡剂[浓度60%～250%(W/V)] 15～60 ml，可立即观察食管及其蠕动情况；在服钡剂前，先服产气药物，可作食道双对比检查。(2) 胃及十二指肠双对比检查：禁食6小时以上，口服产气药物，待胃内产生CO_2气体300～500 ml后，可先口服钡剂[浓度200%～250%(W/V)，黏度150～300 mPas] 70～100 ml，令患者翻转数圈，让钡剂均匀涂布于胃黏膜即可，如有必要可再加服150 ml的钡剂；如在造影检查前20分钟，给患者使用低张药物（如注射山莨菪碱，或口服阿托品等），并口服清胃酶清洗胃液，再行双对比检查，胃黏膜表面结构可更清晰显示。(3) 胃肠单对比随访检查：禁食6小时以上，口服浓度40%～120%(W/V) 钡剂240～480 ml后可立即观察胃与十二指肠的形态及蠕动情况；15～30分钟后可观察小肠的形态及蠕动情况；1个半小时后可观察到所有小肠的形态及蠕动情况；2～6个小时后可观察回盲区和右半大肠。(4) 小肠灌肠检查：禁食8～12小时，将浓度30%～80%(W/V)的钡剂800～2 400 ml经特制导管直接导入十二指肠或近段空肠，行逐段小肠检查。如有必要在单对比检查而直接行双对比检查。(5) 结肠灌肠检查：检查前1～3日进流汁或半流汁饮食，必要时用适量泻剂，并于检查前1～2小时清洁肠道。经肛门插管入结肠，注入对比剂充盈整个大肠进行造影。注入浓度20%～60%(W/V)钡剂后，进行透视和摄片，为单对比造影；然后排出大部分钡剂，再注入气体充盈大肠，为双对比造影。行直接大肠双对比造影时，先通过导管注入浓度60%～80%(W/V) 钡剂150～300 ml，转动体位并注入气体，使钡剂和气体充盈整个大肠，行双对比造影。为取得良好效果，往往在注入对比剂之前，肌内或静脉注射高血糖素或山莨菪碱之类低张药。(6) 儿童：①食管造影，用少量调成糊状吞服。②胃肠造影，用本品100～200 g加水200～500 ml调匀服用。③钡剂灌肠：用本品200 g加水1 000 ml调匀灌肠。

【制剂与规格】硫酸钡（I型）干混悬剂：400 g。

硫酸钡（II型）干混悬剂：① 200 g；② 300 g；③ 500 g；④ 1 000 g。

双重造影产气剂[保(乙)]

【适应证】本品由枸橼酸（含水）、碳酸氢钠、消泡剂及辅料组成。分别制成酸粒后混合分装，其中枸橼酸（含水）与碳酸氢钠的含量为1∶1.3。本品在应用硫酸钡干混悬剂进行上消化道双重造影时，作为产气剂使用。服用3～6 g，产气量

300 ~ 600 ml。

【制剂与规格】双重造影产气颗粒：3 g。

泛影葡胺[基(基)，保(甲)]

Maglumine Diatrizoate

【适应证】用于静脉和逆行性尿路造影；脑、胸、腹及四肢周围血管造影，心血管造影和脑血管造影，静脉造影及CT；还可用于关节腔造影、瘘管造影、子宫输卵管造影、内镜逆行性胰胆管造影及涎管造影。

【注意事项】(1) 腹部血管造影和尿路造影时，如肠内无排泄物和气体干扰，可提高诊断效果。建议患者在检查前2日起，禁食产气食品，尤其是豌豆、黄豆、扁豆、沙拉、水果、黑面包和新鲜面包及所有未烹煮过的蔬菜。(2) 于造影检查前1日，患者应于下午6时后禁食，当晚宜服轻泻剂。但新生儿、婴幼儿和幼儿在检查前禁止长时间禁食和使用泻药。(3) 水化对比剂使用前后必须给予充足的水分。尤其对伴肾病的糖尿病、多尿症、少尿症、高尿酸血症的患者，以及新生儿、婴幼儿、幼儿和老年患者。检查前须纠正水和电解质平衡紊乱。(4) 应用前须作过敏试验，阳性者禁用。(5) 肝、肾功能不全者慎用。(6) 注射速度宜慢，如不良反应严重者应停止注射。

【禁忌证】严重甲状腺功能亢进者、严重肝肾功能不全者、多发性骨髓瘤、活动性肺结核者、对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见轻度反应有恶心、呕吐、流涎、眩晕、荨麻疹；中、重度反应有咽喉水肿、血压下降、呼吸困难等。

【用法与用量】静脉注射：用于周围血管造影，60% 或 76% 注射液一次 10 ~ 40 ml；用于尿路造影，60% 或 76% 注射液一次 20 ml；用于脑血管造影，60% 注射液一次 20 ml 颈动脉注射；用于心血管造影，76% 注射液一次 40 ml。

【制剂与规格】泛影葡胺注射液：① 60% 20 ml；② 60% 100 ml；③ 65% 50 ml；④ 65% 100 ml；⑤ 76% 20 ml。

复方泛影葡胺注射液：每支含泛影酸钠 32 mg，泛影葡胺 268 mg。规格：①1 ml ：0.3 g（供试验用）；② 20 ml ：12 g (60%)；③ 20 ml ：15.2 g (76%)。用于泌尿系造影，心脏血管造影，脑血管造影，其他脏器和周围血管造影，CT 增强扫描和其他各种腔道、瘘管造影，也可用于冠状动脉造影。(1) 心血管造影或主动脉造影：经导管注入心腔，成人常用量 40 ~ 60 ml (76%)，或按体重 1 ml/kg，用压力注射器在2秒钟左右注入，重复注射或与其他造影同时进行时，总量不宜超过 225 ml。小儿常用量按体重 1.0 ~ 1.5 ml/kg (76%)，重复注射总量不宜超过 4 ml/kg。婴幼儿不超过 3 ml/kg。(2) 冠状动脉造影：经导管注入，成人常用量一次 4 ~ 10 ml (76%)，可重复注射，需在心电图监护下注射。(3) 脑血管造影：经导管颈总动脉内注入，成人常用量一次 10 ml (60%)，注射速度每秒不大于 5 ml。经导管椎动脉内注入，成人常用量一次 6 ~ 10 ml。(4) 四肢动脉造影：经导管或经皮穿刺锁骨下动脉或股动脉注入，成人常用量 10 ~ 40 ml (60%)，2 ~ 3 秒注完。(5) 肾动脉造影：经导管注入肾动脉内，成人常用量 5 ~ 10 ml (60%)。(6) 腹腔动脉造影：经导管注入腹腔动脉内，成人常用量 30 ~ 50 ml (76%)，经压力注射器快速注入。(7) 下肢静脉造影：经皮穿刺足背或外侧浅静脉注射，成人常用量 20 ~ 100 ml (30% ~ 50%)。(8) 上肢静脉造影：经皮穿刺前臂或手浅静脉注射，成人常用量 20 ~ 50 ml (30% ~ 50%)。(9) CT 增强扫：50 ~ 150 ml (60% 或 76%)，静脉推注或滴注。(10) 排泄性（静脉）尿路造影：静脉推注（常规法），成人常用量 20 ~ 40 ml (60% 或 76%)。小儿常用量按体重 0.5 ~ 1 ml/kg (60% 或 76%)；也可以6个月以下 5 ml (60%) 或 4 ml (76%)，6 ~ 12 个月 8 ml (60%) 或 6 ml (76%)，1 ~ 2 岁 10 ml (60%) 或 8 ml (76%)，2 ~ 5 岁的 12 ml (60%) 或 10 ml (76%)，5 ~ 7 岁 15 ml (60%) 或 12 ml (76%)，7 ~ 10 岁 18 ml (60%) 或 14 ml (76%)，10 ~ 15 岁的 20 ml (60%) 或 16 ml (76%)。(11) 静脉滴注：成人常用量按体重 2.2 ml/kg (60% 或 76%)，加入等量 5% 葡萄糖注射液，快速滴注。

老年人和心脏病患者速度减慢（注：肾功能减退者在 48 小时内不宜重复造影）。(12) 逆行肾盂输尿管造影：30% 经输尿管导管缓慢注入，成人常用量单侧 10 ~ 15 ml (30%)。(13) 子宫输卵管造影：经宫颈口注入，10 ml (76%)。(14) 术中或术后 T 管胆管造影：10 ml (60%)。(15) 经皮肝穿刺胆管造影：20 ml ~ 40 ml (60%)。

泛影酸钠[保（乙）]

Sodium Diatrizoate

【适应证】用于尿路造影，也可用于肾盂、心血管、脑血管等的造影。

【注意事项】(1) 用前须给予充足的水分，尤其对于多发性骨髓瘤、伴肾病的糖尿病、多尿症、少尿症、高尿酸血症的患者，以及新生儿、婴幼儿、幼儿和老年患者。检查前须纠正水和电解质平衡紊乱。(2) 注射后有过敏反应及低血压时可用肾上腺素抢救。

【禁忌证】严重甲状腺功能亢进者、严重肝肾功能不全者、活动性肺结核者禁用。对本品过敏者禁用。

【不良反应】常见恶心、呕吐、流涎、眩晕、荨麻疹等。

【用法与用量】静脉注射：用于逆行肾盂造影，20% 注射液 6 ~ 10 ml；用于尿路造影，50% 注射液 20 ~ 30 ml。用于脑血管造影，45% 以下注射液 10 ml。用于心脏大血管造影，50% 注射液一次 40 ml。

【制剂与规格】泛影酸钠注射液：① 50% 20 ml；② 50% 30 ml。

碘普胺[保（甲）]

Iopromide

【适应证】用于直接血管造影如动脉、冠状动脉及静脉造影，静脉肾盂造影，尿路造影，关节腔、子宫输卵管造影和窦道造影，也用于 CT 增强对比度。

【注意事项】(1) 对妊娠及哺乳期妇女用药安全尚未确定，应予慎用。(2) 对碘过敏者、肝肾功能不全、心脏和循环功能不全、长期糖尿病、潜在性甲状腺功能亢进者、多发性骨髓瘤者慎用。

【禁忌证】严重甲状腺功能亢进者禁用；孕妇及盆腔炎者禁用作子宫、输卵管造影；对含碘对比剂过敏者禁用。

【不良反应】偶见轻微热感、皮肤发红；少见恶心、呕吐等症状。少数病例静脉造影引起明显的组织反应或变态反应。

【用法与用量】静脉注射或动脉给药：用于 X 线造影，包括心、脑、冠状动脉、胸腹部、外周血管、四肢、泌尿道造影或 CT 增强，剂量见表 20-1。

【制剂与规格】碘普胺 300 注射液：每 1ml 含碘 300mg。① 20ml；② 50ml；③ 100ml。

碘普胺 370 注射液：每 1ml 含碘 370mg。① 20ml；② 50ml；③ 100ml。

胆影葡胺[保（甲）]

Meglumine Adipiodone

【适应证】用于胆管和胆囊造影，用药后显影迅速，可用于急诊。

【注意事项】(1) 下列情况应慎用：过敏体质或有过敏性疾病（如哮喘等）史者；甲状腺功能亢进患者；严重高血压患者；严重心脏疾病患者（如心功能不全等）；活动性结核患者；肝、肾功能损害者；嗜铬细胞瘤、镰状细胞病和多发性骨髓瘤等患者；婴幼儿；老年人。(2) 药物对哺乳的影响尚不明确。(3) 注射本药前应先用本药稀释液（30% 浓度）做对比剂过敏反应试验，阳性反应者禁用。但严重的，甚至致死反应仍可见于试验阴性者。(4) 偶见过敏反应试验剂量即产生严重或致死反应者，故在注射本药时，以及注射后 1 小时内必须严密观察，操作现场应有急症抢救人员并备有复苏抢救器械和药品。对对比剂有严重反应史者，可在造影前使用肾上腺皮质激素或抗组胺药，以预防或减轻造影反应，但效果并不肯定。(5) 注射前预防用药可包括：①检查前 1 日口服 H_1 受体阻滞药氯苯那敏 4 mg；H_2 受体阻滞药西咪替丁 200 mg；泼尼松 5 mg。②检查当日，在注射对比剂前 2 小时，重复 1 次口服上述诸药。③注射前 20 分钟由静脉注射地塞米松 10 ~ 20 mg。(6) 造影前日白天应服少渣、少产气、低脂肪、易消化饮食，忌服奶类制品、鸡蛋等。造影前日晚上服缓泻剂以排除积气及粪便。造

表 20-1 正常成人碘普胺推荐剂量

用途		含碘浓度（mg/ml）	用量（ml）
主动脉造影		300	50 ~ 80
脑血管造影	主动脉弓造影	300	50 ~ 80
	选择性血管造影	300	6 ~ 15(注射 1 ~ 2 次)
胸主动脉造影		300	50 ~ 80
腹主动脉造影		300	40 ~ 60
双侧股动脉造影		300	40 ~ 60
外周血管造影	上肢动脉造影	300	8 ~ 12
	上肢静脉造影	300	15 ~ 30
	下肢动脉造影	300	20 ~ 30
	下肢静脉造影	300	30 ~ 60
心血管造影	心室造影	370	40 ~ 60
冠状动脉造影		370	5 ~ 8
尿路造影		240	1.3 ml/kg
		300	1.01 ml/kg
		370	0.8 ml/kg
数字减数血管造影	静脉注射	240 ~ 370	30 ~ 60
	动脉注射（IA）	240 ~ 370	1.5 ~ 2.5 ml/kg
计算体层摄影	头部	240	1.5 ~ 2.5 ml/kg
		300	1.0 ~ 2.0 ml/kg
		370	1.0 ~ 1.5 ml/kg
	全身	视临床需要定	

影当日晨禁食。(7) 由于注射速度过快可增加碘所致的不良反应并导致胆汁显影不佳，故静脉注射必须缓慢，注射时间不应少于 5 分钟，以减少不良反应，增加显影效果。(8) 本药不宜与任何药物混合使用。(9) 对婴幼儿、老年人、虚弱患者，在注射本药前应补充足量水分，因失水可加重由对比剂渗透性利尿作用所致的反应。(10) 本药 24 小时内不宜重复使用。(11) 在 CT 扫描前 15 ~ 20 分钟可口服 CT 阴性对比剂或水溶液 500 ml 以充盈胃及十二指肠。(12) 可于本药滴注完，CT 扫描前静注 0.2 mg 格隆溴铵类抗胆碱药，以松弛 Oddi 括约肌。(13) 本药用于 CT 静脉滴注胆道造影的原则为增加对比剂剂量，配制大容量溶液，延长全程注射时间。

【禁忌证】(1) 对本药或含碘对比剂过敏者。(2) 严重肝、肾疾病者。(3) 孕妇。(4) 巨球蛋白血症者。

【不良反应】(1) 本药具有渗透性利尿作用，可加重患者的失水状况，对婴幼儿、老年人、氮质血症、失水或虚弱患者可突发虚脱。(2) 注射后可出现热感、瘙痒、出汗、心悸、眩晕、头痛、恶心、呕吐。(3) 个别患者可有荨麻疹、胸闷、面部或喉头水肿等过敏反应，严重时可有震颤、惊厥、呼吸困难、血压降低、心律失常、休克。

【用法与用量】(1) 成人，常规剂量，静脉给药：① X 线静脉胆道造影，先注射 1 ml 后暂停，作短期观察，若无不适反应，再将对比剂缓慢均匀地推入。一般成人用量为 50% 胆影葡胺 20 ml，在 20 分钟左右注射完毕 (1 ml/min)。也可用 5% 葡萄糖注射液等量稀释注射或加入 5% 葡萄糖注射液 100 ml 中缓慢静脉滴注，滴注时间应超过 30 分钟 (4 ml/min)。② CT 静脉滴注胆道造影 (CTIVC)，用 50% 或 30% 本药 40 ml，加入 5% 葡萄糖注射液 160 ml（糖尿病患者可改用 0.9% 氯化钠注射液）共 200 ml 作静脉滴注，滴注速度以 3 ~ 4 ml/min 为宜，在对黄疸或体弱患者还应再减慢滴速，应在 60 分钟内完成滴注全程。其 CT 扫描时间一

般在滴注完毕20～40分钟进行。(2)儿童，常规剂量，静脉给药：X线静脉胆道造影，一般小儿宜用30%溶液0.3～0.6 ml/kg，总量不超过20 ml，缓慢注射至少10分钟以上。余同成人X线静脉胆道造影。

【制剂与规格】胆影葡胺注射液：① 20 ml：6 g（30%）。② 20 ml：10 g (50%)。

碘他拉葡胺[保(乙)]

Meglumine Iothalamate

【适应证】脑血管造影，四肢血管造影，腹部脏器选择性血管造影，排泄性或逆行泌尿道造影，各种直接法胆管造影（包括术中、术后T形管、经内镜逆行胰胆管或经皮肝穿刺肝胆管造影）和计算机处理X线体层摄影（CT）增强扫描。

【注意事项】(1) 使用对比剂前应先做过敏试验。(2) 本品注入冠状动脉易诱发心室颤动，不宜用做选择性冠状动脉造影。(3)本品黏稠度较大，不利于快速注射，注射剂浓度最高60%，不宜做心脏大血管造影。(4) 下列情况应慎用：①过敏体质或哮喘史者（易发生过敏反应)；②肝功能严重损害（增加对肾脏的毒性影响)；③肾功能损害（易引起急性肾衰竭，必须使用本品时应补充足量水分，避免在失水状态下给药)；④严重心脏疾病、心功能不全（对比剂高渗压引起血容量增大，心脏负担加重)；⑤甲状腺功能亢进（易发生甲状腺危象)；⑥活动性结核；⑦严重糖尿病；⑧全身状况严重不良或高热；⑨嗜铬细胞瘤（可诱发高血压危象，必须使用时应限制用量)；⑩多发性骨髓瘤（可促使骨髓瘤蛋白沉积于肾小管内引起急性肾衰竭，必须应用本品时应补充足量水分，限制用量，并使尿液碱化；廉状细胞病者。(5) 某些特殊部位造影时，有下列情况者亦慎用。①脑血管造影。严重动脉粥样硬化，近期发生的脑栓塞，蛛网膜下腔出血，严重高血压。②周围血管造影。闭塞性脉管炎、肢体严重缺血（诱发严重动脉或静脉痉挛)，静脉炎、静脉内血栓形成等。③静脉尿路造影。无尿或糖尿病（易引起急性肾功能衰竭)。④脑CT增强扫描。原发或继发脑内病变（可能引起癫痫发作)，颅内蛛网膜下腔出血（可能引起死亡)。(6) 造影当时和造影后30～60分钟必须严密观察病人有无对比剂反应，现场必须配备抢救人员、器材和药品。(7) 造影前宜禁食一餐，防止因呕吐发生胃内容物吸入气道，但一般可饮水，避免在失水状态下使用本品。(8) 对婴、幼儿、老年人、氮质血症者使用本品前应给予充足的水分补充。本品有渗透性利尿作用，可加剧机体失水状态，静脉尿路造影前不必禁水。(9) 在造影时腹部多次接受X线辐射对胎儿不利；虽然本品尚未见有关临床试验或动物实验报告，但孕妇应用是仍应权衡利弊。

【禁忌证】(1) 碘过敏者禁用。(2) 高胱氨酸尿症者不宜作血管造影，否则会引起血栓形成或栓塞。(3) 本品严禁注入脑室、颅内、椎管内蛛网膜下腔、与蛛网膜下腔交通的囊腔和瘘道。

【不良反应】(1) 血管内注射给药后可出现恶心、呕吐、热感、皮肤潮红、头晕、头痛、出汗、寒战、口干、视物模糊、流泪、涎腺肿胀、皮肤瘙痒、口内异味等症状，一般较短暂，但需要密切观察，它们可能是严重不良反应的先兆，如果症状严重而持续存在，可对症治疗。出现以下症状时应给予治疗，如皮疹或荨麻疹、皮肤或颜面肿胀、舌厚麻木、喘鸣、呼吸困难、胸闷、极度软弱无力（低血压）等。少数患者出现严重反应，包括惊厥、喉头水肿、支气管痉挛、肺水肿、心律失常、休克、心绞痛等需作抢救处理。(2) 下列情况可出现严重反应。①严重糖尿病、肾病、心脏病变者大剂量血管内注射对比剂可引起急性肾衰竭。②脊髓动脉内注射可导致剧痛和不同程度的脊髓损伤，表现为肌无力、截瘫、感觉障碍、尿潴留等。③脑动脉内注射可产生偏瘫、失语、感觉异常、肌肉抽搐、惊厥、昏迷，甚至死亡等。④冠状动脉内注射可产生窦性心动过缓、窦性停博、心脏传导阻滞、各种早博、心动过速、心室颤动和心室舒张末压升高等。这些反应可发生在注射对比剂当时，也可迟至数小时后。经逆行胰胆管插管直接注入本品可诱发急性胰腺炎。(3) 对比剂反应的处理

以对症治疗为主。轻度过敏反应除皮下或肌内注射肾上腺素外，还可静脉输注抗组胺类药物或甾体类皮质激素。严重反应除采用一般抗过敏治疗和给氧、补液外，还应针对不同情况采取相应的急救措施，如维持血压、恢复心律、解痉、抗惊厥和心肺复苏等。一般不宜使用呼吸兴奋药，也不宜在缺氧情况下用肾上腺素。(4) 对比剂误入蛛网膜下腔或脊髓动脉造影后引起严重反应可辅以脑脊液生理氯化钠溶液换洗治疗。

【用法与用量】(1) 脑血管造影：颈动脉或椎动脉内注射，成人常用量一次 6 ~ 10 ml(60%)，重复注射总量控制在 50ml 以内，注射速率每秒 < 5 ml。小儿用量酌减。(2) 四肢动脉造影：成人常用量 20 ~ 40 ml (60%)。小儿用量酌减。(3) 下肢静脉造影：足背外侧静脉穿刺后快速推入，成人常用量 30 ~ 100 ml (30%)。(4) 上肢静脉造影：前臂或手浅静脉穿刺后快速推入，成人常用量 20 ~ 40 ml (60%)。(5) CT 扫描增强：静脉推注，成人常用量 2 ml/kg (60%)，总量 < 150 ml。静脉快速滴注，成人常用量 200 ~ 300 ml (30%)。小儿用量酌减。(6) 排泄性尿路造影：静脉推注，成人常用量 20 ~ 40 ml (60%)，1 ~ 2 分钟注完；小儿常用量，14 岁以下按体重 0.5 ml/kg (60%)，14 岁以上用成人剂量。静脉滴注，成人常用量按体重 4 ml/kg (30%)，总量在 300 ml 以内，速率每分钟 50 ml，心脏病患者减慢速度；12 岁以下小儿剂量酌减，12 岁以上用成人量。肾功能不全者在 24 小时内不宜重复注射。

【制剂与规格】碘他拉葡胺注射液：① 1 ml : 0.125 g；② 10 ml : 6 g；③ 20 ml : 12 g；④ 20 ml : 6 g。

碘苯酯[保(甲)]

Iophendylate

【适应证】主要用于椎管内蛛网膜下腔造影（脊髓造影）也用于脑室和脑池造影，也可用于瘘管造影、手术后 T 形管胆道造影及淋巴管造影。

【注意事项】(1) 对碘发生过敏者对本品也可过敏，因此，使用对比剂前应先做碘过敏试验。(2) 本品注入血管内，可引起血管栓塞。(3) 有哮喘史或其他过敏性疾病史者慎用。(4) 本品密度较脑脊液大，注入蛛网膜下腔后不与脑脊液混合，向低处流动。可以利用改变患者体位和姿势控制对比剂的流向和分布部位，以显示病变节段。但本品表面张力大，易在脑脊液中分散成油珠或节段状，影响诊断。为避免药液分散，翻动患者或改变体位时宜十分缓慢。(5) 本品对脑脊膜有慢性刺激，存留在体内可反复引起过敏反应、无菌性蛛网膜炎和粘连等，造影后要尽可能抽出药液。脑室或脑池造影后可采取体位将本品引流至骶部盲囊后抽出或在手术中吸出。(6) 腰椎穿刺时要尽量避免损伤血管，防止血液进入蛛网膜下腔内。(7) 造影后要取头高足低位卧床 24 小时以上，并补充水分，可减轻术后头痛。

【禁忌证】(1) 对碘或本品过敏者禁用。(2) 有脑脊髓疾患者禁用。(3) 妊娠期妇女禁用。(4) 下列情况禁用本品作蛛网膜下腔造影：禁作腰椎穿刺的各种情况、中枢神经系统炎症、蛛网膜下腔出血；两周内作过腰椎穿刺者，可致本品漏出蛛网膜下腔，影响诊断和引起椎管内油质瘤或肉芽肿和粘连等并发症；疑为或患有多发性硬化症者。

【不良反应】(1) 少数患者出现过敏反应，常见为荨麻疹和血管神经性水肿等症状。(2) 脑室造影后出现：头痛、轻中度发热和呕吐等症状，进入颅内蛛网膜下腔可致脑神经刺激症状。个别报道可引起脑散在性坏死。(3) 椎管蛛网膜下腔造影后出现下列症状：原有神经症状加剧（如瘫痪和腰臀部疼痛加重）、坐骨神经痛、尿潴留、性功能减退等。10% ~ 30% 患者出现头痛、呕吐和轻度发热。症状均属暂时性，少数患者出现肺梗死。(4) 本品长期潴留在体内可致慢性荨麻疹，反复发生过敏反应、局限性癫 等症状，抽去残留药液后症状可缓解或消失。晚期反应有蛛网膜炎、神经根炎、肉芽肿、粘连和颅神经功能障碍，这种反应在血性脑脊液时更趋严重。个别报道可导致甲状腺功能亢进和致盲，后者发生在脊髓造影后 35 日，并发现本品沿视神经分布。

【用法与用量】(1) 椎管内蛛网膜下腔造影（脊髓造影）经腰椎穿刺抽得脑脊液后缓慢注入。成人常用量：腰段，3 ~ 12 ml；胸段，9 ~ 12 ml；颈段，6 ml；椎管阻塞者用量酌减。(2) 脑池造影经腰椎穿刺抽得脑脊液后缓慢注入，常用量，1 ~ 1.5 ml，采用体位和姿势使药液上行进入颅内并充盈桥池侧突和内听道。(3) 脑室造影脑室穿刺后经导管注入，2 ~ 3 ml，利用变换体位和头位，先使对比剂存于前角，再使之流向前角底，经室间孔进入第三脑室、中脑导水管和第四脑室。

【制剂与规格】碘苯注射液：2 ml。

碘番酸[保(甲)]

Iopanoic Acid

【适应证】用于胆囊及胆管造影。

【注意事项】(1) 对碘或其他含碘造影剂过敏者对本品也可能发生过敏。因此，造影前应先做碘过敏试验。(2) 由于造影时腹部要多次接受 X 线辐射，对胎儿不利，孕妇应用时应权衡利弊。(3) 老年人对本品毒性影响较敏感，应避免在数日内连续使用或大剂量使用。在失水情况下服用本品可能导致急性肾衰竭，肝肾疾病患者、老年人应特别注意补充水分，摄入本品前应补充适量水分，避免在失水状态下给药，必要时在服用对比剂后再补充水分。(4) 下列情况可影响胆囊显影：①考来烯胺为一种碱性阴离子交换树脂，有强烈吸附作用；在服用本品同时使用考来烯胺可阻碍本品从肠道吸收，导致胆囊显影淡，甚至不显影；服用本品前至少停用 12 小时以上。②胃肠功能紊乱，如吸收障碍性疾病，小肠炎性病变和腹泻、呕吐等影响本品吸收，可导致胆囊显影淡或不显影。③严重肝功能损害，胆红素浓度 > 3 mg% 时胆囊可不显影。④肝管或胆囊管阻塞，对比剂无法进入胆囊。(5) 对诊断的干扰：①肝功能测定，可增加磺溴酞钠潴留，磺溴酞钠潴留试验至少应在胆囊造影 2 日后方可进行；②甲状腺功能测定，在应用本品后 1 周至数月内可以引起血清蛋白结合碘增高，放射性碘摄取减少，但其他试验，如三碘甲状腺原氨酸树脂摄取试验等并不受影响；③尿液分析，可能在服用本品 3 日内尿蛋白测定出现假阳性结果；④服用本品后可在数天内引起血清胆红素浓度和尿内磺溴酞钠浓度增高。(6) 下列情况慎用本品：①有过敏体质或过敏性疾病（如哮喘等）病史者；②肝功能严重损害（增加肾脏排泄负担和毒性影响）；③肾功能减退（有引起急性肾衰竭的危险）；④失水，尤其是老年人或肝、肾疾病患者（增加发生急性肾衰竭的危险）；⑤冠心病（有出现低血压、心动过缓和急性冠动脉血供不足的危险），近期有冠心病发作史者检查前可给阿托品；⑥甲状腺功能亢进；⑦胆管炎；⑧高尿酸血症（增加产生尿酸结石和肾功能减退的危险，可给足量水分补充，并使尿液碱化预防）；⑨近期胃肠功能障碍者不宜使用本品（影响药物吸收）。

【禁忌证】(1) 严重肝、肾疾病者禁用。(2) 肾功能严重损害（可致急性肾衰竭）者禁用。(3) 碘过敏者禁用。(4) 胃肠道病变，如急性胃肠炎、幽门梗阻等能影响对比剂的吸收，一般不采用口服法造影。(5)胆囊炎急性发作。(6)胆囊胆道手术后。

【不良反应】(1) 可见恶心、呕吐、胃部烧灼感、腹绞痛、腹泻及排尿灼痛或困难等症状，严重者需对症治疗。(2) 少数患者出现瘙痒、皮疹、荨麻疹、皮肤水肿以及其他碘过敏反应，需及时处理。(3) 偶见急性肾衰竭，主要发生在严重肝脏病变、胆管阻塞、失水、超剂量服用或同时使用其他对比剂时。(4) 有引起血小板减少和紫癜的报道。

【用法与用量】口服：成人常用量，一次 3 g；极量，24 小时内一次 6 g。小儿常用量，体重 < 13 kg，按体重口服一次 150 mg/kg；体重 13 ~ 23 kg，口服一次 2 g；体重 ≥ 23 kg，口服一次 3 g 在 X 线检查前 10 ~ 15 小时（一般为造影前一日晚餐）进低脂或无脂饮食后服用本品，其后禁食，但宜多饮水。摄 X 线片前宜清洁灌肠排除肠道内存留的粪便和对比剂，禁用泻剂清洁肠道。

【制剂与规格】碘番酸片：0.5 g。

碘化油[保(甲)]

Iodinated Oil

【适应证】用于支气管造影，子宫输

卵管造影，鼻窦、腮腺管及其他腔道和瘘管造影，也用于预防和治疗地方性甲状腺肿、地方性克汀病及肝恶性肿瘤的栓塞治疗。

【注意事项】(1) 少数患者对碘发生过敏反应。用前应先做口服碘过敏试验。瘘管、窦道造影等，碘化油不在体内潴留，可免做过敏试验。(2) 下列情况慎用本品：①活动性肺结核；②有对其他药物、食物过敏史或过敏性疾病者；③下列情况慎做子宫输卵管造影，如子宫癌（有导致扩散可能）、子宫结核（易引起碘化油反流入血管产生肺动脉碘化油栓塞）；④本品不宜用做羊膜囊造影，因可能引起胎儿甲状腺增生。(3) 支气管造影前要进行支气管表面麻醉。为避免本品进入细支气管以下呼吸单位，干扰诊断和引起肉芽肿，除在灌注时控制用量和灌注速度外，还常在碘化油内加入研磨成细末的磺胺粉，调匀以增加稠度，一般每 20 ml 碘化油中加入 5～10 g，视原有制品稠度和室温适当增减，对磺胺制剂过敏者禁用。碘化油对组织刺激轻微，一般不引起局部症状，但进入支气管可刺激黏膜引起咳嗽，析出游离碘后刺激性增大，且易发生碘中毒。造影结束后利用体位引流并鼓励患者咳出对比剂，不能咽下。若有大量碘化油误入消化道宜采用机械刺激催吐或洗胃吸出，以免碘中毒。(4) 子宫输卵管造影时要控制注射量和压力，在透视下进行，避免挤破血窦引起肺血管油栓，对子宫结核宫腔粘连者尤需注意。(5) 肌内注射要注入深部肌肉组织，并避免损伤血管引起油栓。(6) 碘化油注射液较黏稠，注射时需选用较粗大的针头，避免用塑料注射器。(7) 本品不宜久露于光线和空气中，析出游离碘后色泽变棕或棕褐色者不可再使用。(8) 支气管碘化油造影后碘化油残留肺部可影响 X 线胸部检查，宜在造影前先做胸部 X 线观察；盆腔肿块需要观察钙化者，亦宜在子宫输卵管造影前先摄取盆腔区域 X 线平片，以免进入腹腔的碘化油干扰。

【禁忌证】(1) 对碘过敏者禁用。(2) 甲状腺功能亢进、老年结节性甲状腺肿、甲状腺肿瘤、有严重心、肝、肺疾患、急性支气管炎症和发热患者禁用。(3) 下列情况禁做支气管造影：近期大咯血、急性呼吸道感染或肺炎、高热、肺功能严重低下或体质极度衰弱；下列情况禁做子宫输卵管造影：月经期或其他子宫出血的情况、妊娠（可致流产）。

【不良反应】(1) 偶见碘过敏反应，在给药后即刻或数小时发生，主要表现为血管神经性水肿、呼吸道黏膜刺激、肿胀和分泌物增多等症状。(2) 碘化油对组织刺激轻微，一般不引起局部症状，但进入支气管可刺激黏膜引起咳嗽，析出游离碘后刺激性增大，且易发生碘中毒。(3) 碘剂可促使结核病灶恶化。(4) 本品进入肺泡、腹腔等组织内可引起异物反应，生成肉芽肿。(5) 子宫输卵管碘化油造影有可能引起碘化油进入血管，发生肺动脉栓塞和盆腔粘连、结核性盆腔脓肿恶化等。

【用法与用量】(1) 支气管造影：经气管导管直接注入气管或支气管腔内。成人单侧 15～20 ml (40%)，双侧 30～40 ml；小儿酌减。注入宜缓慢，采用体位使各叶支气管充盈。(2) 子宫输卵管造影：经宫颈管直接注入子宫腔内，5～20 ml (40%)。(3) 各种腔室（如鼻旁窦、腮腺管、泪腺管等）和窦道、瘘管造影：依据病灶大小酌量直接注入。(4) 防治地方性甲状腺肿深部肌内注射，成人常用量，1 000 mg 碘或 3 ml (30%)；小儿常用量，1 岁以下 125 mg 碘，1～4 岁 250 mg 碘，5～9 岁 750 mg 碘，10 岁以上按成人剂量使用。注射一次可维持药效 5 年。(5) 肝癌栓塞治疗：在肝肿瘤供血动脉做选择性插管，或肝总动脉插管，将与抗癌药混匀的碘化油 5～10 ml 注入。

【制剂与规格】碘化油注射液：10 ml，其组分为植物油与碘结合的一种有机碘化合物，含碘 (I) 应为 37.0%～41.0% (g/g)。每支含碘 (I) 应为 2.96～3.28 g。

碘比醇 [保(甲)]

Iobitridol

【适应证】用于（X 线）尿路静脉造影、动脉造影、头颅和全身计算机断层扫描 (CT)、静脉血管数字减影。

【注意事项】(1) 检查应在禁食的情况下进行，对怀疑肾功能受损的患者应先

确定血浆肌酸酐的量，以便确定给药剂量。(2) 检查期间必须由医师进行监护；必须维持一条静脉管；特别注意患有严重的呼吸衰竭，或充血性心力衰竭的患者。(3) 检查前应避免任何脱水，特别是婴儿。有肾衰竭、糖尿病、多发性骨髓瘤、高尿酸血症、幼儿和老年性动脉粥样化的患者须维持充分水分摄入与尿液排出。(4) 必须具备出现危险时急救和复苏的设备，特别是患者服用 β-受体阻断药或已知的情况下或怀疑是黑色素细胞瘤时。(5) 对患有甲状腺功能亢进或良性甲状腺结节的患者提出特别警告。(6) 尿路造影或血管造影前必须进行甲状腺放射性核素扫描或用放射性碘检查，因为碘会短暂地滞留在甲状腺中。

【禁忌证】骨髓 X 线造影术。

【不良反应】含碘对比剂可以引起轻微的、严重的或致命的不良反应，不良反应通常是在给药初期发生，但有时也可能在后期发生。这些不良反应是不可预知的，但通常是发生在有过敏史的病人身上。如风疹、哮喘、花粉热、湿疹、多种食物或药物过敏、或在预先用碘对比剂检查期间有特殊敏感史。用碘试验或同时做的其他试验不能检测出这些不良反应。

【用法与用量】所使用的剂量必须依据检查的方法、部位、体重及肾功能的情况相符，尤其是小孩。建议使用的平均剂量。根据血流动力学的情况可以服用电解质。如果恶化，必须制定一套措施，减轻症状。呼吸器官症状：呼吸减慢与喉头痉挛几乎是同义的，要求用气管插管法加入大剂量的皮质类固醇。神经症状：手足抽搐发作时，一般是采用切断呼吸回路的办法解决，或注射葡萄糖酸钙。肌内注射地西泮可以控制痉挛。有些症状可能发生较晚（24～48 小时）。

【制剂与规格】碘比醇注射液：100 ml ∶ 35 g (I)。

碘佛醇[保(甲)]

Ioversol

【适应证】(1) 主要用于各种血管造影检查，如脑血管造影、周围动脉造影、肾动脉造影和主动脉造影、心血管造影（冠状动脉造影、动脉及静脉性数字减影血管造影）等。(2) 用于静脉性尿路造影及 CT 增强扫描（包括头部和体部 CT）等。

【注意事项】(1) 下列患者慎用：有碘过敏史者，有高危因素的老年人或幼儿，支气管哮喘患者，心功能不全者，肝功能不全者，肾功能不全者（或血清肌酐超过 3 mg/dl 时），甲状腺功能亢进患者。(2) 药物对妊娠及哺乳的影响尚不明确。(3) 对比剂和皮质激素存在化学配伍禁忌，故不能混合在一个注射器内使用。(4) 在造影前应使患者体内保持足够水分。(5) 周围动脉造影注射的动脉必须有搏动，对闭塞性血栓性脉管炎或严重缺血性疾患伴向上蔓延感染，进行造影应极谨慎。(6) 主动脉造影可能引起邻近器官损伤、胸膜穿破、肾损伤。采用腰部技术可能导致腹膜后出血、脊髓损伤及横断性脊髓炎症状。冠状动脉造影应对心电图及生命指征进行监测。(7) 患者患有血栓、静脉炎、严重缺血、局部感染或静脉系统完全堵塞时，建议在透视下操作，以防止注射时对比剂溢出血管外。(8) 本药为非离子型对比剂，抑制血凝的作用比离子型弱，但在进行血管造影时，对操作步骤、时间长短、注射次数、导管及注射器材料仍应予以注意，尽量缩短血液与注射器、导管接触时间，以防可能发生的凝血现象。(9) 发生较重不良反应时，除对症治疗外，应给予抗过敏药物、肾上腺素、吸氧等。发生支气管痉挛致呼吸困难时可给予气管插管。在高危患者，预防用药（地塞米松）可有一定帮助。(10) 患者做完造影后宜观察 1 小时，因偶有延迟反应。(11) 产品有冻结或结晶出现时则不可使用。(12) 过量注射应立即进行对症治疗。本药不与血浆结合，因此可透析清除。

【禁忌证】对碘过敏者。

【不良反应】头痛、恶心、呕吐、荨麻疹、胸闷、热感、疼痛等，多数轻微，但和其他碘对比剂一样也可能发生严重反应，如支气管痉挛甚至过敏性休克。

【用法与用量】(1) 成人：常规剂量：①血管造影（以下剂量可重复，总剂量一般不超过 200～250 ml）。脑血管造影，显示颈动脉或椎动脉需 2～12 ml，使用碘

佛醇 240 或碘佛醇 320 均可。主动脉造影，用碘佛醇 320，一次 60 ml。髂总股动脉造影，一次 40 ml。锁骨下动脉肱动脉造影，一次 20 ml。腹腔动脉造影，一次 45 ml。肠系膜动脉造影，一次 45 ml。肾动脉造影，一次 9 ml。冠状动脉及左室造影，用碘佛醇 320，左冠状动脉 8 ml；右冠状动脉 6 ml；左室造影 40 ml。动脉数字减影血管造影 (IA-DSA) 的用量应少于一般造影剂量的 50%，具体的剂量取决于注射部位。一般采用，颈动脉 6 ~ 10 ml；椎动脉 4 ~ 8 ml；主动脉 25~50 ml；锁骨下动脉 2~10 ml；腹主动脉主要分支 2~20 ml。如必需，可重复注射，总剂量不超过 200 ~ 250 ml。② CT 增强扫描。头部 CT，碘佛醇 320，50 ~ 150 ml；或碘佛醇 240，100 ~ 250 ml，注射结束后可立即扫描。体部 CT，碘佛醇 320 团注 25 ~ 75 ml，滴注 50 ~ 150 ml；或碘佛醇 240 团注 35 ~ 100 ml，滴注 70 ~ 200 ml。③ 静脉数字减影血管造影 (IV-DSA)。根据检查部位，一次注射剂量通常为 30 ~ 50 ml，可重复注射，总剂量不超过 200 ~ 250 ml。④ 静脉尿路造影。碘佛醇 320，50 ~ 75 ml；或碘佛醇 240，75 ~ 100 ml。(2) 儿童，常规剂量：①血管造影。用碘佛醇 320，一般单次注射 1.25 ml (1 ~ 1.5 ml)/kg。多次注射时总量不应超过 5 ml/kg。② CT 增强扫描。头部 CT，碘佛醇 320，一般一次 1 ml (1 ~ 3 ml)/kg，注射结束后可立即扫描。体部 CT，碘佛醇 320，一般一次 1 ml (1 ~ 3 ml)/kg。③静脉数字减影血管造影 (IV-DSA)，碘佛醇 320，一次 1 ~ 1.5 ml/kg，总剂量不超过 3 ml/kg。

【制剂与规格】碘佛醇注射液：①碘含量 1 ml ：160 mgI（碘佛醇 160)；②碘含量 1 ml ：240 mgI（碘佛醇 240)；③碘含量 1 ml ：300 mgI（碘佛醇 300)；④碘含量 1 ml ：320 mgI（碘佛醇 320)；⑤碘含量 1 ml ：350 mgI（碘佛醇 350)。

碘海醇 [保(甲)]

Iohexol

【适应证】用于脊髓造影、静脉造影、血管造影、尿路造影、关节造影、疝造影、子宫输卵管造影等。

【注意事项】(1) 对癫痫患者不易蛛网膜下腔使用。妊娠及哺乳妇女用药安全性未确定，应谨慎。(2) 勿与其他药物混用，并使用专用注射器。(3) 肝肾功能不全、心脏和循环系统功能不全、体质虚弱、进行性脑动脉硬化、糖尿病、甲状腺肿及骨髓白血病者慎用。(4) 对腰段椎管造影，注射时间宜控制在 10 秒，颈段椎管造影宜控制在 30 秒，全椎管造影宜控制在 60 秒。

【禁忌证】严重甲状腺功能亢进者禁用；有变态反应史者、对碘对比剂过敏者禁用。

【不良反应】少数患者静脉注射后有热感，锥管内注射可引起头痛、恶心、呕吐、后背痛、颈部僵硬、麻木。腿和坐骨神经病较少发生，曾有胸痛、心动过速、心动过缓、呼吸暂停、头晕、发热、高血压、低血压、心搏停止、脉管炎、出血、虚脱和休克的报道。偶有癫痫大发作、无菌性脑炎、轻微短暂的神经错乱发生。

【用法与用量】静脉注射：用于 X 线造影，包括脊髓、心血管、动静脉、泌尿道造影及 CT 增强，剂量见表 20-2。

表 20-2 正常成人与儿童碘海醇推荐剂量

用途		含碘浓度 (mg/ml)	用量 (ml)
腰、胸段造影		180	10 ~ 15
		240	8 ~ 12
颈段造影		240	10 ~ 12
CT 扫描脑池造影		180	5 ~ 15
		240	4 ~ 12
儿科脊髓	< 2 岁儿童	180	2 ~ 6
	2 ~ 6 岁儿童	180	4 ~ 10
	> 6 岁儿童	180	6 ~ 12

【制剂与规格】碘海醇 300 注射液：每 1 ml 含碘 300 mg。①10 ml；②20 ml；③ 50 ml；④ 100 ml。

碘海醇 350 注射液：每 1 ml 含碘 350 mg。① 10 ml；② 20 ml；③ 50 ml；④ 100 ml。

碘曲仑[保（乙）]

Iotrolan

【适应证】用于脊髓造影、脑室造影或 CT 脑循环状态造影，用于脑积水检查，还可用于关节腔、子宫、输卵管、乳腺、间接淋巴管、胃肠道及支气管造影。

【注意事项】(1) 大脑痉挛性疾病者禁行蛛网膜下腔造影。孕妇及患急性盆腔炎者禁做输卵管造影。(2) 对脊髓造影前应给足水分，并纠正电解质紊乱。(3) 对精神紧张或紊乱者，可肌内注射苯巴比妥钠 200 mg。待造影监测结束后对高段脊髓造影者，应叮嘱其坐起数分钟，使造影剂尽快流动到腰骶区域，其后至少卧床 24 小时，前 6 小时保持水平位置，并将床头抬高 15°。(4) 对甲状腺肿大者、妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】严重甲状腺功能亢进者禁用。

【不良反应】常见头痛、恶心、呕吐、循环失调、眩晕、颈项强直、颈痛、脑脊髓液细胞计数增高；偶见出汗、轻微肌紧张、视物模糊、过敏等症状。一般于给药 1 ~ 3 日消失。

【用法与用量】静脉注射：用于 X 线造影，包括分段脊髓和全脊髓、脑室和 CT 脑池造影，剂量见表 20-3。

【制剂与规格】碘曲仑 300 注射液：10 ml（每 1 ml 含碘 300 mg）。

碘帕醇[保（甲）]

Iopamidol

【适应证】用于腰、胸、颈段脊髓、脑血管造影，周围动脉及静脉造影，血管造影，冠状动脉造影，尿路、关节造影、CT 增强扫描等。

【注意事项】(1) 孕妇不宜行腹部造影。(2) 患嗜铬细胞瘤或怀疑患该病者，静脉注射本品时，应监测血压。(3) 忌与其他药物配合使用。(4) 肝肾功能不全者、患心血管疾病、糖尿病、老年及有过敏和气喘史者慎用。

【禁忌证】对碘过敏者禁用；甲状腺功能亢进、心脏代偿不全及癫痫患者禁用。

【不良反应】常见头痛；偶见恶心、

表 20-3　正常成人碘曲仑推荐剂量

用　途	含碘浓度（mg/ml）	用量（ml）
脊神经根造影	190	7 ~ 10
腰脊髓造影	190	10 ~ 15
胸段脊髓造影	240	10 ~ 15
颈脊髓（直接从 C_1/C_2 间	240	8 ~ 12
外侧注入）	300	7 ~ 10
颈脊髓（间接从腰部注入）	240	15
	300	8 ~ 15
全脊髓造影	300	10 ~ 15
脑室造影	240 或 300	3 ~ 5
CT 脑池扫描	190	5 ~ 15
	240	4 ~ 12
淋巴管间接造影	300	5 ~ 20
关节腔造影	240 或 300	2 ~ 10
子宫输卵管造影	240 或 300	10 ~ 25
乳腺造影	240 或 300	1 ~ 3
内镜的逆行胆、胰管造影	240 或 300	10 ~ 30
食管 - 胃 - 肠腔管造影	300	10 ~ 100

呕吐、眩晕、精神症状，罕见有轻度癫痫发作。可引起脱水，尤其老年病人、患氮质血症或衰弱患者可能出现休克。

【用法与用量】用于X线造影，用于腰、胸、颈段脊髓造影，脑血管、冠状动脉、泌尿道、关节造影与CT增强，剂量见表20-4。

【制剂与规格】碘帕醇300注射液：每1 ml含碘300 mg。① 10 ml；② 20 ml；③ 50 ml；④ 100 ml。

碘帕醇370注射液：每1 ml含碘370 mg。① 10 ml；② 20 ml；③ 50 ml；④ 100 ml。

碘美普尔[保(乙)]

Iomeprol

【适应证】用于静脉尿路造影（成人包括肾脏损害或糖尿病患者）、CT（躯干）、常规血管造影、动脉、心血管造影（成人和儿童）、常规选择性冠状动脉造影、介入性冠状动脉造影、瘘管造影、乳管造影、泪囊造影和涎管造影。

【注意事项】(1) 肾功能严重损害者、癫痫、低血压、哮喘及其他变态反应性呼吸道病患者慎用。(2) 本品对妊娠期妇女的安全性尚未确立，妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】对碘过敏者禁用；甲状腺功能亢进、心脏代偿不全及癫痫患者禁用。

【不良反应】少见头痛、恶心、呕吐、味觉改变、心动过速、心律失常、心电图异常、肝肾功能改变、变态反应等。

【用法与用量】静脉注射：剂量视造影需要调节。

【制剂与规格】碘美普尔注射液：① 50 ml ：15 g。

碘克沙醇[保(乙)]

Iodixanol

【适应证】用于成人的心血管、脑血管、外周血管造影、腹部血管、尿路造影、静脉造影及CT增强检查。

【注意事项】(1) 在X线造影的过程中应始终保持静脉输液通路畅通，以备抢救急用。(2) 严重心脏病和肺动脉高压者容易出现血流动力学失调及心律失常。(3) 非离子型对比剂有轻微的抗凝活性，因此实施血管造影术中，需不时用肝素化的生理氯化钠溶液冲洗管道，减少血栓形成和栓塞。(4) 为预防对比剂使用后的急性肾衰竭，应注意确保充分的水化，造影术前、后宜多饮水，如有必要，可在监测前开通静脉输液并一直维持到对比剂从肾脏清除。(5) 两次使用对比剂间的间隔应足够长，以保证肾功能恢复到监测前的水平。肾功能障碍者造影后应至少观察30分钟。与其他对比剂一样，在给药前后应保证充足的水分。(6) 必须使用单独的注射器。(7) 肾功能损害者、糖尿病者及有过敏、哮喘、对碘制剂有不良反应史者慎用。有急性脑病、脑瘤、癫痫者可能会引起癫痫发作。饮酒后服药也会增加癫痫发作的机会，对上述患者宜慎用。(8) 对老年患者、甲状腺功能亢进患者及心血管患

表 20-4 正常成人与儿童碘帕醇推荐剂量

用 途	含碘浓度 (mg/ml)	用量 (ml)
脊髓造影	200 ~ 300	成人 5 ~ 15
大脑血管造影	300	成人 5 ~ 10*；儿童 3 ~ 7**
周围动、静脉造影	300	成人 20 ~ 50*
心血管及左心室造影	370	成人 30 ~ 80
冠状动脉造影	370	成人每动脉 4 ~ 8
主动脉造影	370	成人 50 ~ 80
肾动脉造影	370	成人 5 ~ 10
关节造影	300	成人 2 ~ 10
尿路造影	300 ~ 370	成人 20 ~ 50；儿童 1 ~ 2.5
CT 扫描	300 ~ 370	成人 50 ~ 100

* 可在需要情况下重复使用；** 剂量别于不同体形及年龄

者应用应谨慎。

【禁忌证】对有明确的甲状腺毒症表现者、代偿失调的心功能不全者禁用。对妊娠妇女和儿童的安全性尚未确定，不宜应用。

【不良反应】常见轻度感觉异常，如冷热感；外周血管造影时常会引起热感、远端疼痛；少见恶心、呕吐、腹部不适或腹痛；偶见轻度呼吸道和皮肤反应，如呼吸困难、皮疹、荨麻疹、瘙痒和血管神经性水肿；罕见咽喉水肿、支气管痉挛、肺水肿和过敏休克。

【用法与用量】静脉注射：用于心、脑血管造影，外周动脉造影、腹部血管造影、尿路造影、静脉造影和增强CT监测，给药剂量取决于所监测的类型、年龄、体重、心排血量、患者全身情况及所使用的技术。用于动脉内注射的单次剂量，可重复使用。剂量见表20-5。

【制剂与规格】碘克沙醇270注射液：每1 ml含270 mg。① 20 ml；② 50 ml；③ 100 ml。

碘克沙醇320注射液：每1 ml含320 mg。① 20 ml；② 50 ml；③ 100 ml。

钆喷酸葡胺[保(乙)]

Dimeglumine Gadopentetate

【适应证】本品为用于磁共振成像的顺磁对比剂，用于中枢神经（脑、脊髓）、腹部、胸部、盆腔、四肢等人体脏器和组织的磁共振成像，特别适用于肿瘤的诊断。

【注意事项】(1) 本品的增强时间为45分钟，静脉注射后应立即进行MRI检查。(2) 一次用后的剩余药液应弃去。如对检查的结果有较多的疑问，必要时可在第一次注射后30分钟内重复原用剂量1次，以提高检查效果。(3) 肾功能严重损害者慎用；本品对孕妇的安全性尚未确立，妊娠期妇女慎用。

【禁忌证】对核磁共振检查禁忌者禁用。

【不良反应】少见注射部位暂时的轻度发热或痛感、恶心、呕吐、头痛、头晕、短暂味甜感；个别人有皮疹、喉头水肿、瘙痒等过敏性皮肤和黏膜反应；罕见有类过敏性休克；快速给药可能出现短暂性味觉感；给予对比剂后，血浆铁值和血浆胆红素值可能稍有上升，但一般在24小时内恢复正常。

表20-5 正常成人碘克沙醇推荐剂量

用途	含碘浓度（mg/ml）	用量(ml)
动脉内使用：动脉造影		
选择性脑动脉造影	270/320	5 ~ 10
选择性脑动脉数字减影血管造影	150	5 ~ 10
主动脉造影	270 ~ 320	10 ~ 40
外周动脉造影	270/320	10 ~ 30
外周动脉数字减影血管造影	150	30 ~ 60
选择性内脏动脉数字减影血管造影	270	10 ~ 40
血管造影		
左心室与主动脉根注射	320	30 ~ 60
选择性冠状动脉造影	320	4 ~ 8
静脉造影		
尿路造影	270/320	40 ~ 80
静脉造影	270	50 ~ 150（下肢）
CT增强监测		
头部CT	270/320	50 ~ 150
身体CT	270/320	75 ~ 150

【用法与用量】静脉注射：用于颅脑和脊髓磁共振成像、全身磁共振成像，成人和2岁以上儿童0.2 ml/kg，于2分钟内注射完毕，即可获得良好的影像。如需要可在第一次给药后30分钟按上述剂量再注射1次，于90分钟内进行磁共振或成像术。

【制剂与规格】钆喷酸葡胺注射液：① 10 ml ：3.71 g；② 15 ml ：5.57 g；③ 20 ml ：7.42 g。

钆特酸葡胺[保(乙)]

Gadpteric Acid Meglumine Sat

【适应证】本品为用于磁共振成像的顺磁对比剂，用于中枢神经（脑、脊髓）、腹部、胸部、盆腔、四肢等人体脏器和组织的磁共振成像。

【注意事项】【禁忌证】【不良反应】见钆喷酸葡胺。

【用法与用量】静脉注射：用于颅脑和脊髓磁共振成像、全身磁共振成像，成人和2岁以上儿童0.2 ml/kg，于2分钟内注射完毕，即可获得良好的影像。

【制剂与规格】钆特酸葡胺注射液：每1 ml含469 mg。① 10 ml；② 15 ml；③ 20 ml。

钆贝葡胺[保(乙)]

Gadobenate Dimeglumine

Multihance

【适应证】用于中枢神经（脑、脊髓）、腹部、胸部、盆腔、四肢等人体脏器和组织的磁共振成像，特别适用于肝脏特异性造影。

【注意事项】(1) 目前尚无本品用于肾功能损伤者（肌酐清除率每分钟 < 30 ml）的研究，不建议在肾功能不全者应用。(2) 肾功能严重损害者、癫痫、低血压、哮喘及其他变态反应性呼吸道病患者慎用。(3) 本品对妊娠期妇女的安全性尚未确立，妊娠及哺乳期妇女慎用。

【禁忌证】【不良反应】见钆喷酸葡胺。

【用法与用量】静脉注射：用于肝脏造影，成人推荐剂量为0.1 mmol/kg，相当于0.5 mol/L的溶液0.2 ml/kg，对比剂团注后，可立即进行动态增强成像，在肝脏完成早期动态增强成像，于注射后40 ~ 120分钟进行延迟成像。

【制剂与规格】钆贝葡胺注射液：① 5 ml；② 10 ml；③ 15 ml；④ 20 ml。

钆双胺[保(甲)]

Gadodiamide

【适应证】用于中枢神经（脑、脊髓）、腹部、胸部、盆腔、四肢等人体脏器和组织的磁共振成像，特别适用于肝脏特异性造影。

【注意事项】(1) 目前尚无本品用于肾功能损伤者（肌酐清除率每分钟 < 30 ml）的研究，不建议在肾功能不全者应用。(2) 肾功能严重损害者、癫痫、低血压、哮喘及其他变态反应性呼吸道病患者慎用。(3) 药物过量无特殊拮抗药，如有需要可对症处理；因肾功能不良或过量注射发生排泄缓慢时，血液透析可促进本品排泄。(4) 本品须用单独的注射针头或注射器，为保证对比剂完全注射，可应用0.9%氯化钠注射液冲洗静脉注射用导管。

【禁忌证】对磁共振监测禁忌者禁用。妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】少见头痛、恶心、呕吐、味觉改变、心动过速、心律失常、心电图异常、肝肾功能改变、变态反应等。

【用法与用量】静脉注射：用于肝脏造影，增强时间为45分钟，成人推荐剂量为0.1 mmol/kg，相当于0.5 mol/L的溶液0.2 ml/kg，对比剂团注后，可立即进行动态增强成像，在肝脏完成早期动态增强成像，于注射后40 ~ 120分钟进行延迟成像。

【制剂与规格】钆双胺注射液：每1 ml含287 mg。① 10 ml；② 15 ml；③ 20 ml。

铁羧葡胺[保(乙)]

Ferocarbotran

【适应证】可改善病灶的检测如数目、大小、断面的分布，用于肝脏特异性造影。

【注意事项】对过敏体质者（有气喘病史的患者），必须谨慎权衡利弊后才能使用。

【禁忌证】已知对本品任一成分过敏的患者禁用。

【不良反应】少见头痛、恶心、呕吐、味觉改变、心动过速、心律失常、心电图异常、肝肾功能改变、变态反应等。

【用法与用量】静脉注射：用于肝脏造影，增强时间为45分钟，剂量视造影需要。

【制剂与规格】铁羧葡胺注射液：1.4 ml［每1 ml含540 mg，相当于27.924 mg（Fe）/ml］。

六氟化硫微泡[保(乙)]

Sulphur Hexafluoride Microbubbles

【适应证】用于临床诊断，如超声心动、大血管多普勒、小血管多普勒等检查。

【禁忌证】严重肾功能不全者、过氧化氢酶缺乏者、对本品过敏者禁用。伴有右向左分流的心脏病患者、重度肺动脉高压症患者、未控制的高血压患者和成人呼吸窘迫综合征患者禁用。妊娠及哺乳期妇女禁用。

【不良反应】可见头痛、恶心、注射部位疼痛、青肿、灼热和感觉异常。

【用法与用量】静脉注射：在使用前向小瓶内注入0.9%氯化钠注射液，然后用力震摇瓶子，直至冻干粉末完全分散。将微泡混悬液抽吸至注射器后应立即注入外周静脉。随之用氯化钠注射液5 ml冲注。

【制剂与规格】注射用六氟化硫微泡粉末：59 mg。

20.6 常用诊断试剂

布氏菌素[保(甲)]

Brucellin

【适应证】本品为诊断剂。试验阴性者表示可以接种布氏菌活菌苗；阳性者表示已有布氏菌感染或已接种布氏菌活菌苗，产生了免疫力。主要用于检测是否有布氏菌感染或是否具有免疫力。

【注意事项】(1) 注射前应详细询问被试者的职业、健康状况、曾否患过布氏菌病、是否接种过布氏菌苗等。(2) 不能用碘酊消毒皮肤，以免引起假阳性反应。注射时注射液不得从针口漏出。每注射一人更换一次消毒针头。(3) 部分患者注射后局部只有水肿而不发红，需用手指触摸注射部位，判明浸润范围大小，不能单独以皮肤变态反应为诊断依据。(4) 药物应保存在冷暗处，如有浑浊、沉淀、异物者不可使用。

【禁忌证】有药物过敏史、支气管哮喘者禁用。

【不良反应】罕见变态反应。

【用法与用量】皮内注射：一次0.1 ml，注射于前臂掌侧中部皮内，注射后局部有小白疱隆起。48小时后观察，局部红肿达4 cm×6 cm以上为强阳性反应；2 cm×6 cm～4 cm×6 cm者为阳性反应；局部无反应或红肿在2 cm×2 cm以下者为阴性反应。

【制剂与规格】布氏菌素注射液（甲磺酸盐）：① 1 ml；② 2 ml。

旧结核菌素[保(甲)]

Old Tuberculin

【适应证】本品为诊断剂，能使已受结核菌感染或曾受卡介苗免疫的人体引起特异的变态反应。

【注意事项】(1) 本品供测定人体是否感染过结核菌之用，阳性反应者表示曾有结核感染。(2) 人体对旧结核菌素可有变态反应。(3) 注射本品的注射器和针头，不得作其他任何注射之用。(4) 注射液应在冷暗处保存。

【禁忌证】患有急性传染病（麻疹、百日咳、流行性感冒、肺炎等）、急性眼结膜炎、急性中耳炎、广泛性皮肤病患者暂不宜使用。

【不良反应】可见变态反应、注射部位有硬结、严重红肿或感染。

【用法与用量】皮内注射：注射前应用氯化钠注射液稀释至所需的浓度。稀释1 000倍、1万倍、10万倍，在前臂掌侧皮内注射0.1 ml，48～72小时后观察局部反应，结果判定如下：阴性，局部无红肿或红肿直径小于0.5 cm。阳性（+），局部红肿硬结直径超过0.5 cm，但小于1 cm者；(2+)局部红肿硬结直径在1～2 cm者；(3+)局部红肿硬结直径超过2 cm，可伴有小水疱；(4+)局部红肿，并有水疱或脓疱坏死样改变，伴有淋巴结炎。

【制剂与规格】旧结核菌素注射液：1 ml ∶ 10万U。

结核菌素纯蛋白衍生物[保(甲)]

Purified Protein Derivative Tuberculin

【适应证】用于卡介苗接种对象的选择、卡介苗接种后质量监测及临床诊断用。也可用于测量肿瘤病人的细胞免疫功能等。

【注意事项】(1) 注射本品的注射器及针头，不得做其他注射应用。(2) 配制时应小心勿触及皮肤或吸入本品。安瓿如有破裂或有异物者禁用。(3) 注射液应在冷处保存。

【禁忌证】患有急性传染病，如麻疹、百日咳、流行性感冒或肺炎、急性结膜炎、急性中耳炎及广泛性皮肤病者暂不宜使用。

【不良反应】偶见过敏反应。

【用法与用量】皮内注射：用于检查是否感染，第一次试验，前臂掌侧皮内注射0.1 ml（1个结素单位），如呈阴性再皮内注射0.1 ml（5个结素单位），如仍为阴性，方可判定为阴性。用于选择卡介苗接种对象及免疫效果的考核，采用陈孟都法于前臂内侧皮内注射0.1 ml（5个结素单位），48～72小时检查注射部位反应。如有红肿、水疱、坏死、淋巴管炎，或硬结纵、横直径平均≥1.5 cm者为强阳性反应；硬结纵、横直径平均≥5 m者为阳性反应。

【制剂与规格】结核菌素纯蛋白衍生物注射剂：① 1 ml ∶ 20 U；② 21 ml ∶ 50 U。

附 录

附录1 肝脏细胞色素 P_{450} 同工酶与药物代谢的影响

附 1.1 肝脏细胞色素 P_{450} 同工酶

人种和人体差异的奥妙缘于基因，其为编码功能蛋白或 RNA 的核酸片段，作为生物遗传的单位，可在染色体排列成线性的遗传基本单元。当细胞分裂时能自身复制，基因可储备有关遗传的信息。基因有一定的稳定性，但在某些条件下可发生突变，突变后的基因又以新的形式处于稳定状态；基因尚可重组，可在不同物种上进行交换，在新的位置上复制、转录、翻译。基因在医药学的位置十分重要，不仅用于基因工程制药（疫苗、单抗）、疾病鉴别、诊断和治疗，且又与药物相互作用的发生机制密切相关，其中由于肝细胞色素 P_{450} 同工酶的活性和代谢密切相关。

肝脏的细胞色素 P_{450} 同工酶（Cytochrome P_{450} Isodynamic Enzyme）是血红蛋白超级家族，它是内质网膜上混合功能氧化酶系统的末端氧化酶。这些为同工酶是由于其与一氧化碳结合和还原时，采用分光光度法测得的吸收峰均在 450 nm 波长附近，因此统称为 P_{450}。现已清楚认识到 CYP 可参与外源性物质（如药物、乙醇、抗氧化剂、有机溶剂、染料、化学制品）的代谢。它们在氧化、过氧化和还原内源性生理化合物，如甾体、胆汁酸、脂肪酸、前列腺素等代谢方面起重要作用。

早期研究证实细胞色素 P_{450} 有多种类型，但并不知道不同物种和组织有相似的同功异构体。研究人员根据同工酶的光谱特性、电泳泳动度或其底物将其分别命名。随着人们认识氨基酸顺序的迅速进展，其将同工酶及基因分为家族酶、亚家族酶和个体酶，均以“CYP”为词首来命名所有物种的细胞色素 P_{450} 同工酶。在该系统中，对所有来源的细胞色素 P_{450} 蛋白的氨基酸若有 40% 以上的同一性，则归于同一家族，并以阿拉伯数字标示。亚家族酶由氨基酸顺序有 55% 以上相似的酶组成，以大写字母标示，字母后面的阿拉伯数字表示不同的酶，与酶相关的基因则用斜体字表示。比如，CYP2 家族有几个亚家族，诸如 CYP2C、CYP2D、CYP2E。数字代表不同的个体酶，如 CYP2D6，基因则用 *CYP2D6* 表示。

CYP 系统可催化多种反应，包括环氧化、N- 去烷基化、O- 去烷基化、S- 氧化及脂肪族和芳香族残基的羟化反应。氧化反应可使化合物激活或失活。和所有的酶一样，细胞色素 P_{450} 同工酶呈饱和动力学，其活性需要辅助因子，并可被诱导或抑制。如苯巴比妥可诱导 CYP2B，肾上腺皮质激素可诱导 CYP3A，乙醇可诱导 CYP2E 及氯贝丁酯可诱导 CYP4A。

迄今为止，在人体中已发现至少有 700 种以上与 CYP 相关的基因，且在不断发展，多数与 P_{450} 系统和药物肝脏代谢有关。其中 CYP1、CYP2、CYP3 家族约占肝脏 P_{450} 含量的 70%，并负责大多数药物的代谢。

附 1.2 酶促药和酶抑制药

肝脏的细胞色素 P_{450} 同工酶具有活性，遗传、年龄、营养、机体状态和疾病等均可影响酶的活性；同时有些药品也可诱导或抑制它的活性，分别被称为“肝药酶诱导药或酶促药”或“肝药酶抑制药或酶抑药”。

所谓“酶促”即对 P_{450} 酶有诱导作用，使酶的活性增加，自身的代谢加快和使酶对药物的代谢速度加快（包括首关效应）而提前失效，而对于前药，可加速其转化为活性药而出现作用和疗效。这种作用称为酶诱导作用。具有这种作用的药物称为酶诱导药。由于加速了自身的消除，从而产生耐受性，并且使其他依赖药酶消除的药物药效降低，作用时间缩短，停药后可

恢复，酶诱导药分为苯巴比妥类药物和芳香族烃两类。苯巴比妥类诱导药中有苯巴比妥、卡马西平、苯妥英钠、格鲁米特、甲苯磺丁脲，能引起肝大，平滑内浆网增生，不但能诱导肝药酶，亦可能提高小肠多种生物转化酶的活性，其他尚有安替比林、扑米酮、利福平等。芳香烃类诱导药为二噁英、二甲荃苯并蒽、甲基胆蒽等化学品。

"酶抑"与之相反，其抑制酶的活性，使酶对药物的代谢速度减慢（包括首关效应）而延迟效果和提高血浆浓度，即为酶抑制药。属于"酶抑"的药品众多，如甲硝唑、别嘌醇、环丙沙星、甲氧苄啶、胺碘酮、奎尼丁、异烟肼、红霉素、氯霉素等。

附 1.3 由酶促和酶抑所产生的药物相互作用

附 1.3.1 酶抑作用

一般而言，酶抑作用所致的代谢性相互作用的临床意义远大于酶促作用，约占该酶系统全部相互作用的 70%，如震惊全球的药品不良事件"特非那定""西立伐他汀"事件都是由酶抑作用引起的。

血脂调节药羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药（他汀类药）在治疗剂量下与对 CYP3A4 有明显抑制的环孢素、依曲康唑、酮康唑、红霉素、阿司咪唑、HIV 蛋白酶抑制药、抗抑郁药奈法唑酮等合用能显著增高他汀类药的血浆水平。尤其不宜与吉非贝齐、烟酸合用，国内外诸多的报道证实西立伐他汀或联合吉非贝齐使用时，可干扰 CYP2C8 和 CYP2C19，出现肌痛、肌无力的致死性横纹肌溶解症。2001 年美国报道已有 31 例患者在服用后死亡，迄今已发现 52 例，因而被撤出市场。

又如帕罗西汀主要通过 CYP2D6 代谢，代谢中又与 CYP2D6 辅酶基结合可抑制 CYP2D6 活性。而 CYP2D6 与多种抗精神病药、β 受体拮抗药、抗心律失常药的代谢有关。在帕罗西汀与酚噻嗪类药合用中，显示 CYP2D6 活性下降 2～21 倍，美索达嗪血浆浓度出现了明显升高，引起了 Q-T 间期延长，室性心律不齐等严重不良反应，因此目前已将两药作为配伍禁忌。

又如质子泵抑制药（proton pump inhibitor，PPI）在人体内主要经 CYP2C19 代谢，其次是 CYP3A4 代谢，亚洲人约 20% 为 CYP2C19 的慢代谢型（PM），中国人群中发生率也高达 15%～17%，如奥美拉唑的 PM 和快代谢型（EM）血药浓度相差约 7 倍，代谢若被抑制，则发生不良反应的风险将大大增加。在大环内酯类抗生素中，克拉霉素、红霉素是 CYP3A4 强抑制药（也是 CYP3A4 的底物），阿奇霉素、罗红霉素则对 CYP3A4 的抑制作用较弱，故与 PPI 合用时应选择阿奇霉素或罗红霉素。相比较于未服 CYP3A4 抑制药的红霉素，PM 对 CYP3A4 的抑制作用（如克拉霉素引起的）能成倍增加奥美拉唑的 AUC，并且引起 PM 个体中这种药物的 AUC 升高 10 倍。因而可预料，CYP3A4 被抑制的患者对 PPI 治疗 Hp 感染的反应可能更好，但同时也更易引起严重的不良反应（肌痛、心悸、眩晕、肢端麻木、嗜睡等）。

附 1.3.2 酶促作用

酶促药巴比妥类药与抗凝药并用，则使抗凝药的代谢大大增加。乙醇、抗组胺药、镇静催眠药可强化巴比妥类的作用；反之巴比妥类药也能加速其他药品的代谢，如苯妥英钠、甲睾酮、环孢素、洋地黄毒苷、氢化可的松、黄体酮、茶碱、多西环素、对乙酰氨基酚、氯霉素等，使上述药品代谢速度加快，血浆药物浓度降低，同时效价降低。

另外，CYP3A4 和 CYP2D6 是阿立哌唑的主要代谢同工酶，因此，与 CYP3A4 和 CYP2D6 抑制药或酶促药联合应用时宜调整剂量。当与 CYP3A4 诱导药卡马西平合用时应增加剂量至一日 20～30mg，与 CYP3A4 抑制药酮康唑合用时，应减少剂量；与 CYP2D6 抑制药奎尼丁、氟西汀、帕罗西汀合用时，阿立哌唑应至少减为正常剂量的 1/2。

附 1.4　常见的酶促药和酶抑药

附 1.4.1　主要被 CYP1A2 代谢的药物

阿米替林、氯丙嗪、氯米帕明、氯氮平、杜洛西汀、氟奋乃静、氟伏沙明、丙米嗪、米拉托林、奋乃静、普罗帕酮、雷美替胺、硫利达嗪、替沃噻吨、三氟拉嗪、咖啡因、西那卡塞特、环苯扎林、达卡巴嗪、埃罗替尼、氟他胺、夫罗曲坦、利多卡因、美西律、萘普生、昂丹司琼、华法林、普萘洛尔、罗哌卡因、他克林、茶碱、替扎尼定、佐米曲普坦、奥氮平。

附 1.4.2　主要被 CYP2B6 代谢的药物

安非他酮、环磷酰胺、依法韦仑、异环磷酰胺、氯胺酮、哌替啶、美沙酮、丙泊酚、舍曲林、司来吉兰、他莫昔芬、甲睾酮。

附 1.4.3　主要被 CYP2C9 代谢的药物

氟西汀、舍曲林、丙戊酸钠、塞来昔布、双氯芬酸、氟比洛芬、布洛芬、吲哚美辛、氯诺昔康、萘普生、吡罗昔康、舒洛芬、替诺昔康、氯磺丙脲、格列吡嗪、格列美脲、格列本脲、那格列奈、罗格列酮、甲苯磺丁脲、波生坦、坎地沙坦、氟伐他汀、厄贝沙坦、氯沙坦、苯巴比妥、苯妥英钠、他莫昔芬、S-华法林、四氢大麻酚、托塞米。

附 1.4.4　主要被 CYP2C19 代谢的药物

阿米替林、西酞普兰、氯米帕明、地西泮、艾斯西酞普兰、氟硝西泮、丙米嗪、氟西汀、吗氯贝胺、舍曲林、曲米帕明、美芬妥英、埃索美拉唑、兰索拉唑、奥美拉唑、泮托拉唑、雷贝拉唑、卡立普多、环磷酰胺、异环磷酰胺、奈非那韦、氯胍、华法林、普萘洛尔、甲苯磺丁脲、伏立康唑、伊曲韦林、苯妥英钠、地西泮、多塞平、美沙酮、奋乃静、雷尼替丁、他莫昔芬。

附 1.4.5　主要被 CYP2D6 代谢的药物

苯丙胺、阿米替林、阿立哌唑、托莫西汀、苯扎托品、氯丙嗪、氯米帕明、地昔帕明、多塞平、杜洛西汀、氟西汀、氟伏沙明、氟哌啶醇、丙米嗪、去甲替林、帕罗西汀、奋乃静、利培酮、舍曲林、硫利达嗪、文拉法辛、氯苯那敏、羟嗪、卡维地洛、美托洛尔、普萘洛尔、噻马洛尔、可待因、氢可酮、羟考酮、曲马多、多拉司琼、多柔比星、恩卡尼、甲氧氯普胺、美西律、普罗帕酮、雷尼替丁、他莫昔芬、托特罗定、托烷司琼、珠氯噻醇、右美沙芬。

附 1.4.6　主要被 CYP3A4 代谢的药物

阿普唑仑、阿米替林、阿立哌唑、丁螺环酮、卡马西平、西酞普兰、氯米帕明、氯氮平、地西泮、艾司唑仑、佐匹克隆、氟西汀、氟哌啶醇、咪达唑仑、萘法唑酮、匹莫齐特、喹硫平、利培酮、舍曲林、曲唑酮、扎来普隆、苄普地尔、齐拉西酮、唑吡坦、丁丙诺非、可卡因、芬太尼、氯胺酮、美沙酮、羟考酮、苯环利定、红霉素、罗红霉素、地红霉素、交沙霉素、克拉霉素、泰利霉素、酮康唑、氟康唑、咪康唑、伊曲康唑、卡马西平、乙琥胺、噻加宾、唑利沙胺、氯雷他定、非索那定、氟替卡松、沙美特罗、齐留酮、硝苯地平、尼群地平、尼莫地平、非洛地平、氨氯地平、左氨氯地平、拉西地平、乐卡地平、依拉地平、皮质激素类、去氧孕烯、炔雌醇、孕激素、长春新碱及其类似药、阿瑞匹坦、西那卡塞特、埃索美拉唑、伊立替康、格拉司琼、那格列奈、奥美拉唑、吡格列酮、奎尼丁、西地那非、阿托伐他汀、普伐他汀、辛伐他汀、托特罗定。

附 1.4.7　主要被 NAT2 代谢的药物

卡泊芬净、肼屈嗪、异烟肼、普鲁卡因胺、瑞替加滨、柳氮磺吡啶、磺胺嘧啶、致癌性芳香族和杂环胺类药物、联苯胺、氟硝西泮。

附 1.4.8　常见 CYP_{450} 抑制药

附 1.4.8.1　CYP1A2 抑制药

阿昔洛韦、胺碘酮、阿扎那韦、咖啡因、西咪替丁、环丙沙星、依诺沙星、法莫替丁、氟他胺、氟伏沙明、利多卡因、洛美沙星、美西律、吗氯贝胺、诺氟沙星、氧氟沙星、奋乃静、普罗帕酮、罗匹尼罗、他克林、噻氯匹定、妥卡尼、维拉帕米。

附

录

附 1.4.8.2 CYP2B6 抑制药

氯吡格雷、依法韦仑、氟西汀、氟伏沙明、酮康唑、美金刚、奈非那韦、帕罗西汀、利托那韦、噻替哌、噻氯匹定。

附 1.4.8.3 CYP2C9 抑制药

胺碘酮、阿那曲唑、西咪替丁、地拉韦啶、依发韦仑、非诺贝特、氟康唑、氟西汀、氟伏沙明、氟伐他汀、异烟肼、酮康唑、来氟米特、莫达非尼、舍曲林、磺胺甲噁唑、他莫昔芬、替尼泊苷、丙戊酸钠、伏立康唑、扎鲁司特、氟尿嘧啶、帕罗西汀、硝苯地平、尼卡地平。

附 1.4.8.4 CYP2C19 抑制药

青蒿素、氯霉素、地拉韦啶、依法韦仑、埃索美拉唑、非尔氨酯、氟康唑、氟西汀、氟伏沙明、吲哚美辛、莫达非尼、奥美拉唑、口服避孕药、奥卡西平、噻氯匹定、伏立康唑、氟伐他汀、洛伐他汀、尼卡地平、扎鲁司特、丙戊酸钠、异烟肼、胺碘酮。

附 1.4.8.5 CYP2D6 抑制药

胺碘酮、阿米替林、安非他酮、塞来昔布、氯苯那敏、氯丙嗪、西咪替丁、西那卡塞特、西酞普兰、氯米帕明、地昔帕明、苯海拉明、多塞平、杜洛西汀、卤泛群、氟哌啶醇、羟嗪、丙米嗪、美沙酮、甲氧氯普胺、吗氯贝胺、帕罗西汀、普罗帕酮、奎尼丁／奎宁、利托那韦、舍曲林、特比奈芬、硫利达嗪、噻氯匹定。

附 1.4.8.6 CYP3A4 抑制药

胺碘酮、氨普那韦、阿瑞匹坦、阿托那韦、西咪替丁、环丙沙星、克拉霉素、地那韦啶、地尔硫䓬、多西环素、依诺沙星、红霉素、氟康唑、氟伏沙明、伊马替尼、茚地那韦、伊曲康唑、酮康唑、咪康唑、奈法唑酮、泊沙那唑、利托那韦、沙喹那韦、泰利霉素、维拉帕米、伏立康唑。

附 1.4.9 NAT2 抑制药

对乙酰氨基酚。

附 1.4.10 常见 CYP_{450} 诱导药

附 1.4.10.1 CYP1A2 诱导药

卡马西平、埃索美拉唑、灰黄霉素、胰岛素、兰索拉唑、莫雷西嗪、奥美拉唑、利福平、利托那韦。

附 1.4.10.2 CYP2B6 诱导药

洛匹那韦、利托那韦、苯巴比妥、苯妥英钠、利福平。

附 1.4.10.3 CYP2C9 诱导药

阿瑞匹坦（长期）、巴比妥类、波生坦、卡马西平、利福平、地塞米松、利托那韦、圣-约翰草（长期）。

附 1.4.10.4 CYP2C19 诱导药

银杏制剂、利福平、圣-约翰草、利托那韦、依法韦仑、地塞米松。

附 1.4.10.5 CYP2D6 诱导药

利福平、苯妥英钠、苯巴比妥、卡马西平。

附 1.4.10.6 CYP3A4 诱导药

阿瑞匹坦（长期）、巴比妥类、波生坦、卡马西平、依法韦仑、非尔氨酯、糖皮质激素、莫达非尼、奈韦拉平、奥卡西平、苯妥英钠、苯巴比妥、扑米酮、依曲韦林、利福平、圣-约翰草、吡格列酮、托吡酯（大于一日 200 mg）。

附 1.4.11 NAT2 诱导药

维 A 酸。

附录2 药物相互作用

A型肉毒抗毒素
Botulinum Toxin Type A

氨基糖苷类抗生素（如庆大霉素等）能加强A型肉毒抗毒素的作用，禁忌并用。

α-硫辛酸　α-Lipoic Acid

α-硫辛酸可能降低顺铂的疗效。

β-七叶皂苷钠　Sodium Aescinate

与血清蛋白结合率高的药物、肾毒性药物、皮质激素类药物联合应用时应谨慎。

阿苯达唑　Albendazole

（1）与西咪替丁、地塞米松或吡喹酮合用，可增加本品不良反应。（2）本品抑制茶碱的代谢，增加茶碱毒性反应。（3）本品禁与哌嗪类药合用；少数蛔虫感染较严重者于服药后可引起蛔虫游走，造成腹痛或口吐蛔虫，甚至引起窒息，此时应加用左旋咪唑或噻嘧啶等药以避免。

阿达帕林　Adapalene

不应同时使用其他有相似作用机制的维A酸类药物或其他药物。

阿夫唑嗪　Alfuzosin

（1）与其他α受体拮抗药：合用有发生严重低血压的危险，避免合用。（2）钙通道阻滞药：合用有发生严重低血压的危险，避免合用。（3）西咪替丁：可增加本品的血药峰浓度。（4）其他抗高血压药：增加抗高血压作用和发生直立性低血压的危险。

阿卡波糖　Acarbose

（1）服药期间，由于结肠内糖类酵解增加，蔗糖或含蔗糖的食物常会引起腹部不适，甚至导致腹泻。（2）与磺酰脲类、二甲双胍或胰岛素合用，可能会出现低血糖，故需减少降糖药的剂量。（3）个别情况下会影响地高辛的生物利用度，需调整地高辛剂量。（4）避免与考来酰胺、肠道吸附药和消化酶类制剂合用，以免影响本品的疗效。

阿立哌唑　Aripiprazole

（1）与其他作用于中枢神经系统的药物和乙醇合用时应慎重。（2）有可能增强某些抗高血压药的作用。（3）氟西汀、帕罗西汀、奎尼丁、酮康唑可抑制本品代谢，使本品血浆药物浓度升高。（4）卡马西平可降低本品血浆药物浓度。

阿伦膦酸钠　Alendronate Sodium

如同时服用钙剂、抗酸药物和其他口服药物，可能会干扰本品吸收。

阿罗洛尔　Arotinolol

（1）与利血平、丙吡胺、普鲁卡因胺、阿马林合用可出现心功能过度抑制症状。（2）降糖药：增强降血糖作用。（3）钙通道阻滞药互相增强作用。（4）可乐定可增强停药后的反跳现象。（5）洋地黄类：出现心脏传导阻滞。（6）非甾体抗炎药：减弱本品的降压作用。

阿洛西林　Azlocillin

（1）与庆大霉素、妥布霉素、多黏菌素合用有协同作用，对铜绿假单胞菌和部分肠杆菌感染可提高疗效，但不宜在同一容器内注射。（2）与丙磺舒合用可提高血浆药物浓度。（3）与肝素、双香豆素及非甾体抗炎药合用，可诱发出血。

阿米洛利　Amiloride

（1）与氯化铵合用易发生代谢性酸中毒。（2）甘珀酸钠、甘草类制剂具有醛固

酮样作用，可降低本品的利尿作用。

阿米替林 Amitriptyline

（1）西咪替丁、哌甲酯、抗精神病药、钙通道阻滞药等CYP抑制药可降低本品代谢，导致血浆药物浓度增高，易引起或加重不良反应，甚至产生中毒症状。（2）巴比妥类等CYP诱导药可加速本品的代谢，降低血浆药物浓度，减弱抗抑郁作用。（3）与单胺氧化酶抑制药合用或先后用药，可引起严重不良反应。如两药换用时，间隔时间应超过2周。（4）硫糖铝可明显影响本品吸收，使阿米替林AUC减少约50%。（5）与抗惊厥药合用，可降低癫痫阈值，降低抗惊厥药作用，故需调整抗癫痫药剂量。（6）与延长心电图Q-T间期的药物合用时，会增加室性心律失常的风险。（7）与甲状腺激素同时服用，易导致心律失常。（8）吸烟可使阿米替林血浆药物浓度降低。（9）阿米替林可提高机体对乙醇的反应性，如过量饮酒易致酒精中毒。

阿莫西林 Amoxicillin

（1）克拉维酸可增强阿莫西林对产生β-内酰胺酶细菌的抗菌活性。（2）丙磺舒可使阿莫西林的血浆浓度提高45%～68%。

阿那曲唑 Anatrozole

（1）不宜与雌激素同用。（2）他莫昔芬可降低本品疗效。

阿扑吗啡 Apomorphine

（1）先期服用止吐药，可降低阿扑吗啡的催吐效应。（2）对中枢神经系统产生抑制作用的吩噻嗪类镇吐药与本品合用，可致严重的呼吸和循环抑制，产生不良反应或延长睡眠。（3）纳洛酮可以对抗本品的催吐作用对中枢神经与呼吸等的抑制。（4）在服用口服避孕药期间服用本品，可使本品镇静作用减弱。

阿奇霉素 Azithromycin

（1）抗酸药可抑制阿奇霉素的吸收。（2）阿奇霉素可能升高茶碱的血浆药物浓度。与地高辛合用，使后者血浆浓度升高。（3）与麦角胺或双氢麦角胺合用可致严重的末梢血管痉挛和感觉迟钝。

阿曲库铵 Atracurium Besilate

（1）本品不宜与硫喷妥钠等碱性药物合用。（2）与吸入性麻醉药如氟烷、异氟烷及恩氟烷合用，可增加本品神经肌肉阻滞作用。（3）与氨基糖苷类及多肽类抗生素、锂、镁盐、普鲁卡因胺及奎尼丁合用时，会增加本品的神经阻滞作用。

阿柔比星A Aclarubicin A

先用亚硝脲类或丝裂霉素治疗，再用本品可增强骨髓的抑制作用，应注意。

阿柔比星B Aclarubicin B

先用亚硝脲类或丝裂霉素治疗，再用本品可增强骨髓的抑制作用，应注意。

阿司匹林 Aspirin

（1）布洛芬：合用布洛芬会干扰阿司匹林对血小板的不可逆抑制作用，两药合用布洛芬可使阿司匹林的心血管保护作用受限。（2）高剂量的其他含水杨酸盐的非甾体抗炎药：增加溃疡和胃肠道出血的风险。（3）促尿酸排泄的抗痛风药（如丙磺舒、磺吡酮）：降低促尿酸排泄的作用（竞争肾管尿酸的消除）。（4）地高辛：由于减少肾清除而增加地高辛的血浆浓度。（5）利尿药：与高剂量的阿司匹林合用时减少肾前列腺素的合成而降低肾小球滤过。（6）血管紧张素转换酶抑制药（ACEI）：与高剂量阿司匹林合用通过抑制前列腺素而减少肾小球滤过。此外，降低ACEI的抗高血压作用。（7）丙戊酸钠：与血浆蛋白竞争结合而增加丙戊酸钠的毒性。（8）乙醇：由于阿司匹林和乙醇的累加效应，增加对胃十二指肠黏膜的损害，并延长出血时间。（9）抗酸药如碳酸氢钠等可增加本品自尿液中的排泄，使血浆药物浓度下降，不宜同用。（10）与对乙酰氨基酚长期大量合用可引起肾脏病变。（11）与任何可引起低凝血酶原血症、血小板减少、血小板聚集功能降低或胃肠道溃疡出血的药物同用，有加重凝血障碍及引起出血的危险。（12）与抗凝药、溶栓药合用，可增加出血的危险。（13）尿碱化药、抗酸药可使本品血浆药物

浓度下降。但当本品血药溶度已达稳定状态而停用碱性药物。又可使本品血浆药物浓度升高到毒性水平。(14) 糖皮质激素可增加水杨酸盐的排泄，大量应用时，有增加胃肠溃疡和出血的危险性。(15) 胰岛素或口服降糖药的降糖效果可因与本品同用而加强和加速。(16) 与甲氨蝶呤合用可减少其从肾脏的排泄，使血浆药物浓度升高而增加毒性反应。

阿糖胞苷 Cytarabine

(1) 与其他抗肿瘤药或骨髓抑制药、放疗合用，可能增加药物的细胞毒性和免疫抑制作用。(2) 可使地高辛稳态浓度和肾葡萄糖分泌可逆性下降。(3) 不宜与氟尿嘧啶并用。

阿替卡因 Articaine

本品制剂内常加入肾上腺素，因此不建议与其他药物合并使用。

阿替洛尔 Atenolol

其他抗高血压药物及利尿药：加强其降压效果。

阿替普酶 Alteplase

(1) 与影响凝血功能的药（包括香豆素类、肝素）合用，可显著增加出血的危险性。(2) 与依替贝肽合用，因协同作用可增加出血的危险性。(3) 与硝酸甘油合用，因增加肝脏的血流量，使本品的血浆浓度降低及冠状动脉的再灌注减少、再灌注时间延长、血管再闭塞的可能性增加。

阿托伐他汀 Atorvastatin

（见辛伐他汀）

阿托品 Atropine

(1) 与异烟肼合用，本品的抗胆碱作用增强。(2) 本品与盐酸哌替啶合用有协同解痉和止痛作用。(3) 奎尼丁与本品的抗胆碱作用相加，故可增强本品对迷走神经的抑制作用。(4) 本品可增加地高辛的吸收。(5) 本品与维生素 B_2 合用，可使维生素 B_2 的吸收增加。(6) 将少量高张氯化钠溶液加入本品中肌内注射，可显著延长本品改善心率作用的时间。(7) 硫酸镁：本品抑制胃肠蠕动增加镁离子吸收，故本品中毒忌用硫酸镁导泻。(8) 胆碱酯酶复活药（解磷定、氯解磷定等）与本品有互补作用，合用时可减少本品剂量和不良反应，提高治疗有机磷中毒的疗效。(9) 抗组胺药可增强本品外周和中枢效应，也可加重口干或一过性声音嘶哑、尿潴留及眼压增高等不良反应。(10) 氯丙嗪可增强本品致口干、视物模糊、尿潴留及促发青光眼等不良反应。(11) 碱化尿的药物（包括含镁或钙的抗酸药、碳酸酐酶抑制药、碳酸氢钠、枸橼酸盐等）合用时，可延迟本品排泄、增加作用时间和毒性。(12) 与单胺氧化酶抑制药（包括呋喃唑酮、丙卡巴肼等）合用时，可产生兴奋、震颤或心悸等不良反应。必须联用时本品应减量。(13) 本品可加重胺碘酮所致的心动过缓。(14) 与甲氧氯普胺并用时，后者的促进肠胃运动作用可被拮抗。(15) 与左旋多巴合用，可使左旋多巴吸收量减少。(16) 在使用本品的情况下，舌下含服硝酸甘油、戊四硝酯、硝酸异山梨酯的作用减弱。(17) 抗酸药能干扰本品的吸收，故两者合用时宜分开服用。(18) 普萘洛尔可拮抗本品所致的心动过速。(19) 地西泮、苯巴比妥钠可拮抗本品中枢兴奋作用。(20) 乙醇：本品与乙醇的中枢抑制作用相加。

阿西美辛 Acemetacin

(1) 与青霉素、丙磺舒合用，可使本品排泄减慢。(2) 与抗高血压药合用可减弱后者的疗效。(3) 与补钾利尿药合用可引起高钾血症。(4) 与乙醇和其他非甾体抗炎药如阿司匹林、水杨酸类以及糖皮质激素合用时，胃肠道不良反应明显增强，并有导致出血的危险。与阿司匹林联合用可减低本品的血浆浓度。(5) 与地高辛并用时，可使其血浆浓度增加。(6) 与抗凝药、肝素合用可抑制血小板聚集，增加出血的可能性。(7) 与呋塞米合用可加快本品的排泄。

阿昔洛韦 Aciclovir

(1) 与碘苷、阿糖腺苷、安西他滨、

干扰素合用具有协同作用。(2)与更昔洛韦、膦甲酸钠、酞丁安合用具有相加作用。(3)与膦甲酸钠联用时，能增强本品对单纯疱疹病毒感染的抑制作用。(4)与齐多夫定合用，可引起肾毒性，表现为深度昏睡和疲劳。(5)与肾毒性药合用，可加重肾毒性。(6)与干扰素或甲氨蝶呤（鞘内）合用，可能引起精神异常。(7)大剂量与哌替啶合用，可发生哌替啶中毒。(8)与丙磺舒合用，可致本品在体内蓄积。

埃索美拉唑　Esomeprazole

(1)可提高经CYP2C19代谢药物的血浆药物浓度，如地西泮。(2)CYP3A4抑制药克拉霉素可使本品AUC加倍。(3)可增加促胃肠动力药的吸收。(4)减少酮康唑、伊曲康唑、铁的吸收。

艾司洛尔　Esmolol

(1)交感神经节阻滞药：合用有协同作用。(2)华法林：本品的血浆药物浓度会升高，但临床意义不大。(3)吗啡：可使本品的稳态血浆药物浓度升高。(4)地高辛：地高辛的血浆药物浓度可升高。(5)氯琥珀胆碱：延长氯琥珀胆碱的神经肌肉阻滞作用。(6)肾上腺素：本品会降低肾上腺素的药效。(7)维拉帕米：合用于心功能不良患者会导致心脏停搏。

氨苯蝶啶　Triamterene

(1)糖皮质激素、雌激素：能减弱本品的利尿作用。(2)非甾体抗炎药：尤其是吲哚美辛，能降低本品的利尿作用，且合用时肾毒性增加。(3)多巴胺：加强本品的利尿作用。(4)引起血压下降的药物：利尿和降压效果均加强。(5)血管紧张素转换酶抑制药、血管紧张素Ⅱ受体拮抗药：增加发生高钾血症的机会。(6)地高辛：使地高辛半衰期延长。(7)噻嗪类和襻利尿药：因可使血尿酸升高，应与治疗痛风的药物合用。(8)降糖药：本品可使血糖升高，合用时降糖药剂量应适当加大。(9)不宜与含钾药物或其他保钾药物合用。(10)本品、丙磺舒及磺胺吡唑二酮均有排尿酸作用，同时使用可使排尿酸作用增强，但本品的利尿作用可被丙磺舒减弱。

氨苯砜　Dapsone

(1)丙磺舒可减少氨苯砜自肾小管分泌，使砜类血药浓度升高而持久，或发生毒性反应，在合并用药时宜减少或调整剂量。(2)利福平可刺激肝脏微粒体酶，减低氨苯砜的作用和降低血浆浓度1/10～1/7，在联合应用时宜调整后者的剂量。

氨苄西林　Ampicillin

(1)与别嘌醇合用可使本品皮疹样反应的发生率增加，尤见于高尿酸血症者。(2)与氯霉素合用，远期后遗症的发生率较之两药单用时为高。(3)氨苄西林降低口服避孕药的效果。

氨苄西林-舒巴坦

Ampicillin-Sulbactam Sodium

与丙磺舒同服可延缓本品排泄和提高其血浆浓度。

氨茶碱　Aminophylline

(1)地尔硫䓬、维拉帕米、西咪替丁、美西律、红霉素、罗红霉素、克拉霉素、依诺沙星、环丙沙星、氧氟沙星、左氧氟沙星、克林霉素、林可霉素等可降低茶碱清除率，增加茶碱的血浆药物浓度和（或）毒性，合用时应减量并监测茶碱血浆药物浓度。(2)苯巴比妥、苯妥英钠、利福平可诱导肝药酶，使茶碱血浆药物浓度降低；茶碱也干扰苯妥英钠的吸收，使两者血浆浓度均下降，合用时应调整剂量，并监测血浆药物浓度。(3)与锂盐合用时，可加速肾脏对锂的排出。(4)与咖啡因或其他黄嘌呤类药合用，可增加其作用和毒性。

氨基己酸　Aminocaproic Acid

(1)本品可拮抗链激酶、尿激酶的作用，若后两药过量时可给予本品对抗。(2)与避孕药或雌激素合用，有增加血栓形成的可能。同时给予高度激活的凝血酶原复合物或抗纤维蛋白溶解药物，有血栓再形成的危险。

附录

氨基葡萄糖 Glucosamine

氨基葡萄糖可使华法林的抗凝作用增强（避免合用）。

氨基糖苷类抗生素

（1）吲哚美辛可能升高新生儿阿米卡星和庆大霉素的血药浓度。（2）新霉素降低青霉素V的吸收；氨基糖苷类抗生素和多黏菌素E或多黏菌素类合用增加肾毒性；氨基糖苷类抗生素和卷曲霉素、替考拉宁或万古霉素合用增加肾毒性和耳毒性。（3）临床经验提示新霉素和香豆素或苯茚二酮合用国际标准化比率（INR）可能会改变。（4）新霉素可能增强阿卡波糖的降糖作用，同时胃肠道反应也有所增加。（5）两性霉素B合用增加肾毒性的危险。（6）双膦酸盐类合用增加低钙血症的危险。（7）庆大霉素可能会升高地高辛的血药浓度；新霉素降低地高辛的吸收。（8）环孢素合用增加肾毒性的危险。（9）新霉素可能降低甲氨蝶呤的吸收；铂类化合物合用增加肾毒性，可能增加耳毒性。（10）襻利尿药合用可增加耳毒性。（11）增强非去极化肌松药和氯琥珀胆碱的作用，以免加强神经－肌肉阻滞，甚至引起呼吸骤停，与骨骼肌松弛药、麻醉药联合应用应慎重。（12）可拮抗新斯的明和嗅吡斯的明的作用。（13）他克莫司合用有增加肾毒性的危险。（14）新霉素可能降低维生素A的吸收。

氨甲苯酸 Aminomethybenzoic Acid

与硝普钠配伍可降低疗效。

氨甲环酸 Tranexamic Acid

（1）与其他凝血因子合用，有形成血栓的可能，或在应用凝血因子8小时后可考虑应用。抗高血压药：与硝普钠配伍合用可降低疗效。（2）与口服避孕药、雌激素、苯唑西林钠或凝血酶原复合物浓缩药合用，有增加血栓形成的危险。

氨鲁米特 Aminoglutethimide

（1）本品影响皮质类激素或香豆素类抗凝药的体内代谢。（2）可诱导肝药酶，而使洋地黄及茶碱类药物减效。

氨氯地平 Amlodipine

（1）麻醉药：同时与烃类麻醉药合用时，引起低血压。（2）非甾体抗炎药：尤其与吲哚美辛同用时，可减少本品的降压作用。（3）肾上腺素β受体拮抗药：可增强降压作用，可增加充血性心力衰竭的发生。

氨曲南 Aztreonam

（1）与氨基糖苷类抗生素联用，有协同抗菌作用，但应定期检查肾功能；与头孢西丁有拮抗作用。（2）可能增强香豆素类抗凝药的作用。（3）可能增加利尿药的肾毒性。

氨溴索 Ambroxol

（1）合用可升高阿莫西林、阿莫西林／克拉维酸、氨苄西林、头孢呋辛、红霉素、多西环素等抗生素在肺组织的分布浓度，产生协同作用。（2）与β_2肾上腺素受体激动药、茶碱等支气管扩张药合用时有协同作用。

胺碘酮 Amiodarone

（1）华法林：增加华法林的抗凝作用。（2）Ⅰa类抗心律失常药：可加重QT间期延长，极少数可致扭转型室性心动过速。（3）β受体拮抗药或钙通道阻滞药：合用可加重窦性心动过缓、窦性停搏及房室传导阻滞。（4）地高辛：增加血清地高辛浓度，加强洋地黄类药对窦房结及房室结的抑制作用。（5）排钾利尿药：增加低钾血症所致的心律失常。（6）可抑制甲状腺对^{123}I、^{133}I及^{99m}Tc的摄取。

奥氮平 Olanzapine

（1）氟伏沙明、环丙沙星等CYP1A2抑制药可抑制本品代谢，合用时应减少本品剂量。（2）卡马西平、奥美拉唑、利福平等CYP1A2诱导剂及吸烟可增加本品的清除率，降低其疗效。（3）与乙醇或其他中枢神经抑制药合用，可显著加重中枢抑制作用。（4）应避免与可引起心电图QT间期延长的药物合用。（5）可拮抗多

巴胺受体激动药的作用。

奥卡西平 Oxcarbazepine

(1) 可降低苯妥英钠及苯巴比妥的代谢，使其血浆药物浓度升高，毒性增加。(2) 与锂盐合用神经系统不良反应增加。(3) 可使二氢吡啶类钙通道阻滞药的AUC降低。(4) 与激素类避孕药同用可能导致避孕药失效。(5) 本品可使卡马西平、拉莫三嗪血药浓度降低。

奥美拉唑 Omeprazole

(1) 可提高胰酶的生物利用度。(2) 抑制某些经肝脏代谢的药物，如双香豆素，氯吡格雷等的代谢。(3) 影响铁剂吸收。(4) 与缓释和控释制剂同用，使药物溶出加快。

奥曲肽 Octreotide

(1) 合用可使环孢素和西咪替丁的吸收降低。(2) 与溴隐亭合用会增加后者的生物利用度。(3) 因生长抑素类似物会抑制CYP3A4酶，故合用主要通过该酶代谢且疗效范围较窄的药物时应小心。

奥昔布宁 Oxybutynin

(1) 解痉药或其他产生口干、便秘、嗜睡药物或其他抗胆碱能药：能增加上述药物的作用的强度和不良反应严重程度。(2) 抗胆碱能药：影响本品的吸收。

奥硝唑 Ornidazole

(1) 同其他硝基咪唑类药相比，本品对乙醛脱氢酶无抑制作用。(2) 奥硝唑能抑制抗凝血药华法林的代谢，使其半衰期延长，增强抗凝血药的药效。当与华法林合用时，应注意观察凝血酶原时间并调整给药剂量。(3) 与巴比妥类药、雷尼替丁和西咪替丁等药合用，可使奥硝唑加速消除而降效并可影响凝血，因此禁忌合用。(4) 同时应用苯妥英钠、苯巴比妥等诱导肝微粒体酶的药物，可加强本品代谢，使血浆药物浓度下降，而苯妥英钠排泄减慢。(5) 本品可延缓肌肉松弛药维库溴铵的作用。

奥扎格雷 Ozagrel

抗血小板聚集药、血栓溶解药及其他抗凝药：合用可增强出血倾向，应慎重合用。

巴氯芬 Baclofen

(1) 与卡马西平和苯妥英钠有协同作用。(2) 与碳酸锂合用可出现运动功能亢进。(3) 与抗高血压药合用，可使降压作用增强。(4) 服用本品的患者加用布洛芬后，可加重本品的毒性反应（表现为运动失调、定向力障碍、心动过缓、低血压、体温过低等)。(5) 与抗抑郁药物合用，可引起短期的记忆力丧失。(6) 与三环类抗抑郁药合用，可加强巴氯芬的作用，引起明显肌张力过低。(7) 患震颤麻痹者同时接受巴氯芬和左旋多巴加卡比多巴治疗，有报道引起精神错乱、幻想和激动不安。(8) 乙醇与其他中枢抑制药可增加本品的中枢抑制作用。

巴尼地平 Barnidipine

（见乐卡地平）

巴曲酶 Batroxobin

(1) 与抗凝药及血小板抑制药合用可能会增加出血倾向或止血时间延长。(2) 与溶栓药合用可能引起血栓、栓塞症。

白细胞介素-2 Interleukin-2

本品与具有肝、肾、心或脊髓毒性的药物合用时，毒性增加，糖皮质激素可降低本品的治疗作用；β受体拮抗药和其他抗高血压药物能加重本品所致的低血压。

白消安 Busulfan

(1) 服本品的同时或曾于短期内用过其他抑制骨髓的药物或放射治疗，则会增加总的作用，应根据病情酌减剂量。与环磷酰胺合用，可使其清除率明显降低，从而增加不良反应的发生率。(2) 与苯妥英钠或苯妥英钠合用，本品血药浓度降低。(3) 与硫鸟嘌呤长期合用，可能发生肝结节状增生、食管静脉曲张和门静脉高压，

合用时应密切监测肝功能。至少要停止使用本品3个月后，才可接种活疫苗。

贝伐单抗 Bevacizumab

一项研究表明，IFL方案联用本品时伊利替康的活性代谢物SN38的血中浓度比单用IFL方案（相同剂量）平均增高33%。

贝那普利 Benazepril

（见卡托普利）

贝诺酯 Benoride

（1）乙醇可加剧本品对胃黏膜的损害作用，服用期间不宜饮酒。（2）与香豆素类抗凝药合用，可增加出血倾向。（3）本品可抑制丙磺舒、磺吡酮的促尿酸排泄作用，大剂量尤为明显。

倍氯米松 Beclomethasone Dipropionate

（1）本品可能影响甲状腺对碘的摄取、清除和转化。（2）胰岛素能与本品产生拮抗作用，糖尿病患者应注意调整用药剂量。

苯巴比妥 Phenobarbita

（1）与氟哌啶醇联合应用治疗癫痫时，可引起癫痫发作形式改变，需要及时调整剂量。（2）与吩噻嗪类和四环类抗抑郁药物合用时可降低抽搐阈值。

苯丙哌林 Benproperine

本品与抗胆碱药、三环类抑郁药、吩噻嗪类药、单胺氧化酶抑制药合用可能增强抗胆碱作用。

苯丙酸诺龙 Nandrolone Phenylpropionate

可增强抗凝血药香豆素、华法林等的抗凝作用；与糖皮质激素合用，可使血糖升高。

苯海拉明 Diphenhydramine

（1）本品可短暂影响巴比妥类药的吸收。（2）与对氨水杨酸钠同用，可降低后者血浆药物浓度。（3）可增强中枢抑制药的作用。

苯海索 Trihexyphenidyl

（1）与乙醇或中枢神经系统抑制药合用可加强中枢抑制作用。（2）与金刚烷胺、抗胆碱药、单胺氧化酶抑制药合用加强抗胆碱作用，并可发生麻痹性肠梗阻。（3）与抗酸药或吸附性止泻药合用，减弱本品疗效。（4）与氯丙嗪合用，本品血浆药物浓度降低。（5）与强心苷类合用，本品吸收增加易中毒。（6）与下列药物合用可能使不良反应率增加：三环类抗抑郁药、抗组胺药、氯氮平、丙吡胺、奈福泮、酚噻嗪类。（7）合用多潘立酮、氟哌啶醇、甲氧氯普胺、硝酸盐类使后者作用降低。（8）合用酮康唑、左旋多巴使后者吸收减少。（9）合用美金刚使本品作用增强。（10）合用拟副交感神经药，副交感神经反应增强。

苯妥英钠 Phenytoin Sodium

（1）抗凝药（如香豆素类）、磺胺类、西咪替丁、甲硝唑、氯霉素、克拉霉素、异烟肼、吡嗪酰胺、氟康唑、维生素B_6、保泰松、氯苯那敏、舍曲林、地昔帕明、氟伏沙明、氟西汀、氯噻嗪、哌甲酯、氯巴占、奥卡西平、地尔硫䓬、硝苯地平等可降低本品的代谢，从而增强本品的效果和（或）毒性。与香豆素类抗凝药合用时，开始可增加抗凝效应，但持续应用则效果相反。（2）加巴喷丁可使本品发生毒性反应的风险增加。（3）布洛芬、卡倍西他滨、阿奇霉素可提高本品的血浆药物浓度，出现中毒症状。（4）与单胺氧化酶抑制药，合用时可增强本品的毒性（包括肝毒性），甚至引起肝坏死。（5）本品可增加胺碘酮的代谢，使后者疗效降低；但其本身代谢减少，从而增加毒性（包括共济失调、反射亢进、眼球震颤和肢体震颤等）。（6）长期应用对使用对乙酰氨基酚的患者可增加肝脏中毒的危险性，且疗效降低。（7）长期应用多巴胺的患者，静脉注射本品时可因儿茶酚胺耗竭，引起突发性低血压及心率减慢，且与本品的用量及吸收速度有关。使用多巴胺的患者，需用抗惊厥药时，不宜采用苯妥英钠。

苯溴马隆 Benzbromarone

若与阿司匹林及其他水杨酸类制剂、依他尼酸、噻嗪类利尿药、吡嗪酰胺同服，可拮抗尿酸的排泄，减弱本品的作用。

苯扎贝特 Bezafibrate

（见非诺贝特）

苯唑西林 Oxacillin

（1）抗痛风药丙磺舒可阻止本品的排泄，提高血浆浓度和延长作用时间。（2）与西梭米星、奈替米星联合应用可增强对金葡球菌的抗菌作用；与氨苄西林、庆大霉素联合应用可增强对肠球菌的作用。（3）非甾体抗炎药阿司匹林或磺胺药在体外可抑制本品与血浆蛋白的结合作用增强；磺胺药可减少本品在胃肠道的吸收。

比马前列素（贝美前列素）滴眼液 Bimatoprost Eye Drops

本品可以与其他滴眼剂同时使用以降低眼内压。如果同时使用多种治疗药物，则每两种药物的使用应至少间隔 5 分钟。

比沙可啶 Bisacodyl

（1）不宜与可产生尖端扭转型的抗心律失常药合用。（2）与洋地黄合用易诱发其毒性作用。

比索洛尔 Bisoprolol

（1）与 I 类抗心律失常药（如丙吡胺、奎尼丁）合用，可增强延长心房传导时间和负性肌力作用。与Ⅲ类抗心律失常药物（如胺碘酮）合用，可能延长心房传导时间。（2）拟交感神经药物：可能延长房室传导时间。（3）麦角胺类衍生物：增加外周循环的阻力。（4）维拉帕米或地尔硫䓬类钙通道阻滞药或其他抗心律失常药：出现低血压、心动过缓等。（5）麻醉药：减弱反射性心动过速，增加低血压的风险。（6）洋地黄类：减慢心率，延长房室的传导时间。（7）前列腺素合成酶抑制药：减弱降血压作用。（8）甲氟喹：增大心动过缓的危险性。

吡格列酮 Pioglitazone

（1）与口服避孕药合用，两者药效均会降低。（2）本品通过 CYP3A4 酶代谢，应注意与 CYP3A4 抑制药间的相互作用。

吡拉西坦 Piracetam

本品与华法林合用，可延长凝血酶原时间，可诱导血小板聚集的抑制。

吡罗昔康 Piroxicam

本品不宜与阿司匹林联用。与双香豆素等抗凝药同时服用，可增加后者的效应，宜调整剂量。

吡哌酸 Pipemidic Acid

（1）丙磺舒可抑制由创面吸收后的本品的肾小管分泌，合用时后者血浆药物浓度升高，半衰期延长。（2）本品可减少咖啡因自肝脏清除，使后者半衰期延长，需避免合用，或监测咖啡因血浆药物浓度。（3）本品可显著降低茶碱的清除，致后者血浆药物浓度升高，易于发生毒性反应，两者不宜合用，如需合用应监测茶碱浓度并调整给药剂量。（4）与庆大霉素、羧苄西林、青霉素等常具协同作用。

吡嗪酰胺 Pyrazinamide

（1）与钙神经通道调控药或与环孢素合用，可降低后者的疗效。（2）与别嘌醇、秋水仙碱、丙磺舒、磺吡酮合用，可增加血尿酸浓度，同时降低上述药物治疗痛风的疗效。（3）与异烟肼、利福平合用有协同作用，可明显减轻关节痛的发生，并可延缓耐药性的产生；与乙硫异烟胺合用可增加不良反应的发生率。

吡柔比星 Pirarubicin

与环磷酰胺、巯嘌呤、甲氨蝶呤、氟尿嘧啶、顺铂有协同作用。

表柔比星 Epirubicin

表柔比星主要在肝脏代谢，任何能引起肝功能改变的药物将会影响表柔比星的疗效与毒性。紫杉醇类药物会增加表柔比星的血药浓度，但如先给表柔比星则对其

药动学无影响。

别嘌醇 Allopurinol

（1）本品与环磷酰胺联用，会加重对骨髓抑制。本品可使硫唑嘌呤、巯嘌呤等嘌呤类药物在体内的代谢受抑制，提高其作用 2 ~ 4 倍，并增加毒性，因此如与这些药物联合应用时，应将这两药减至常用量的 1/4。（2）本品不可与氯化钙、维生素 C、磷酸钾（或钠）同服，因可增加肾脏中黄嘌呤结石的形成。（3）应避免与布美他尼、呋塞米及吡嗪酰胺合用，因可增加血尿酸浓度。本品可增加烷化剂类药物的毒性，故在治疗恶性肿瘤引起的继发性高尿酸血症时，应在化疗（若用烷化剂）前接受本品治疗。本品可延长丙磺舒的血浆半衰期，丙磺舒则可增加本品的代谢产物别黄嘌呤的排泄，当两药合用于慢性痛风的治疗时，应减少丙磺舒的剂量，并增加别嘌醇的剂量。（4）本品可抑制肝药酶活性，减慢口服抗凝药等药的代谢，在合用时应减少后者的用量，并需监测凝血酶原的活性。

丙吡胺 Disopyramide

（1）与其他抗心律失常药合用时可进一步延长传导时间，抑制心功能。（2）与中至大量乙醇合用，低血糖及低血压发生机会增多。（3）与华法林合用时抗凝作用可更明显。

丙泊酚 Propofol

（1）与苯二氮䓬类药物、副交感神经阻断药或吸入麻醉药合用时，可延长麻醉时间并降低呼吸频率。（2）和氯琥珀胆碱或新斯的明合用后，可能出现心动过缓或心搏骤停。（3）应用芬太尼后，丙泊酚的血药浓度可短暂性升高。

丙磺舒 Probenecid

（1）丙磺舒抑制卡托普利、吲哚美辛、酮洛芬、萘普生、酮咯酸、美罗培南、头孢菌素、环丙沙星、萘啶酸、诺氟沙星、青霉素类、氨苯砜、呋喃妥因、阿昔洛韦、更昔洛韦、齐多夫定、甲氨蝶呤等的排泄（增加毒性发生的危险）。（2）阿司匹林拮抗丙磺舒的作用，吡嗪酰胺拮抗丙磺舒的作用。（3）丙磺舒可能增强氯磺丙脲的降血糖作用。

丙卡巴肼 Procarbazine

（1）不宜与丙米嗪、胍乙啶、利血平等并用，以免增加其降压作用。（2）本品可增加巴比妥、硫喷妥钠及抗组胺类药的作用。（3）与箭毒并用，可增加肌肉松弛作用，可致呼吸困难。（4）可增强降糖药作用，故用本品时应尽量避免并用。

丙卡特罗 Procaterol Hydrochloride

（1）本品应避免与肾上腺素及异丙肾上腺素等合用，否则会引起心律失常、心率增加。（2）并用茶碱类药时，可增加舒张支气管平滑肌作用，但不良反应也增加。（3）应避免与单胺氧化酶抑制药及三环类抗抑郁药同时应用。

丙硫氧嘧啶 Propylthiouracil

（1）与口服抗凝药合用可致后者疗效增加。（2）磺酰脲类等都有抑制甲状腺功能和致甲状腺肿大的作用，故合用本品时需注意。（3）此外，高碘食物或药物的摄入可使甲状腺功能亢进病情加重，使抗甲状腺药需要量增加或用药时间延长，故在服用本品前应避免服用碘剂。

丙硫异烟胺 Protionamide

与其他抗结核药合用可能增加其不良反应。

丙酸氟替卡松鼻喷雾剂 Fluticasone Propionate Nasal Spray

应避免与利托那韦合用。

丙戊酸镁 Magnesium Valproate

(1) 本品能抑制苯妥英钠、苯巴比妥、扑米酮、乙琥胺的代谢，使血浆药物浓度升高。与氯硝西泮合用可引起失神性癫痫状态，不宜合用。(2) 抗酸药可降低本品的血浆药物浓度。(3) 阿司匹林能增加本品的药效和毒性作用。(4) 与抗凝血药如华法林、肝素及溶栓药合用，使出血的危险性增加。(5) 与卡马西平合用，由于肝

酶的诱导作用而致药物代谢加速，可使两者的血浆药物浓度和半衰期均降低。

丙戊酸钠 Sodium Valproate

（1）西咪替丁、红霉素、克拉霉素等与本品合用，因肝内代谢减少，可增加本品的血浆药物浓度。（2）本品可增强全麻药或中枢神经系统抑制药的临床效应。（3）与阿司匹林或双嘧达莫合用，可减少血小板聚集，延长出血时间。（4）本品可增加齐多夫定的口服生物利用度，并增加齐多夫定的毒性作用。（5）本品可增强抗凝药（如华法林、肝素）及溶栓药的作用，出血的危险性将增加。

伯氨喹 Primaquine

（1）蒿甲醚／本芴醇应避免其与伯氨喹合用。（2）米帕林与氯胍可抑制本品代谢，可升高伯氨喹的血药浓度。

博来霉素 Bleomycin

与抗肿瘤药或放疗药合用应注意可能诱发间质肺炎，肺纤维化；头颈部放疗可加重口内炎、口角炎、喉头黏膜炎、诱发黏膜炎症。

布地奈德 Budesonide

酮康唑可增加口服布地奈德的血药浓度，伊曲康唑也使布地奈德的血浓度升高。

布地奈德福莫特罗粉吸入剂 Budesonide and Formoterol Powder for Inhalation

（1）与其他 CYP3A4 强抑制药合用会显著增加布地奈德的血浆药物浓度。（2）β 受体拮抗药能减弱或抑制福莫特罗的作用，不宜合用。（3）与奎尼丁、丙吡胺、普鲁卡因胺、吩噻嗪、抗组胺药（特非那定）、单胺氧化酶抑制药和三环类抗抑郁药合用使用可延长 QTc 间期，并增加室性心律不齐的危险。（4）左旋多巴、左甲状腺素、缩宫素和乙醇也可损害心脏对 β_2 受体激动药的耐受性。（5）同时与单胺氧化酶抑制药合用，包括特性相似的物质，如呋喃唑酮和丙卡巴肼，可能会突然引起高血压反应。（6）患者同时接受含卤素麻醉时，发生心律失常的危险增高。（7）同时使用其他 β 肾上腺药物则有潜在的相加作用。（8）对于正在使用洋地黄毒苷的低钾血症患者发生心律失常的可能性增加。

布林佐胺 Brinzolamide

与碳酸酐酶抑制药合用，可能出现全身不良反应。

布洛芬 Ibuprofen

（1）饮酒或与其他非甾体抗炎药同时使用，会增加胃肠黏膜的刺激，也有引起溃疡的危险；与阿司匹林或其他水杨酸类药物同时服用时不能增加疗效，而胃肠道不良反应及出血倾向增高。（2）与抗凝药同用，会增加出血倾向。（3）本品可增加抗糖尿病药的作用；降低抗高血压药物的降压作用。（4）与糖皮质激素类同用，可明显地减缓炎症症状。（5）本品可降低甲氨蝶呤的排泄，增高其血浆药物浓度，甚至可达中毒水平，故不宜同用。（6）与丙磺舒和维拉帕米、硝苯地平同用时，要注意降低剂量；与地高辛同用时，注意调整地高辛的剂量。

布美他尼 Bumetanide

（见呋塞米）

布托啡诺 Butorphanol

(1) 在使用布托啡诺的同时，使用中枢神经系统抑制药如巴比妥类催眠镇静药、地西泮和抗组胺药会导致抑制中枢神经系统的作用增强。当与这些会加强类阿片药作用的药物合用时，布托啡诺的用量应为最小有效剂量，随后的剂量应尽可能降低。(2) 目前还不能确定与影响肝脏代谢的药物（如西咪替丁、红霉素、茶碱等）合用是否影响布托啡诺的作用，但内科医师应留心减小起始剂量并延长给药间歇。(3) 使用布托啡诺时合用单胺氧化酶抑制药是否有相互影响尚未证实。

茶苯海明 Dimenhydrinate

（1）同服可使乙醇、中枢神经抑制药、三环类抗抑郁药等增效。（2）本品能短

暂地影响巴比妥类和磺胺醋酰钠等吸收。(3)同用氨水杨酸钠可使其血药浓度降低。

茶碱 Theophylline

(1)与麻黄碱或其他拟交感胺类支气管扩张药合用可使其毒性增强。(2)与克林霉素、林可霉素及某些大环内酯类(红霉素、罗红霉素、克拉霉素)、喹诺酮类抗菌药(依诺沙星、环丙沙星)、别嘌醇(大剂量)、西咪替丁及口服避孕药合用可使茶碱血浆药物浓度增高。(3)与利福平、苯巴比妥、氨鲁米特、戊巴比妥及异丙肾上腺素(静注)合用可使茶碱血清浓度降低;茶碱与苯妥英钠合用时,两者血浆药物浓度均降低。(4)与锂盐合用时,可加速肾脏对锂的排出,后者疗效降低。(5)应用茶碱的患者最好避免使用非选择性 β 受体拮抗药,因为两者药理作用相互拮抗。

长春地辛 Vindensine

合用其他有降低白细胞的药物应减量;与放疗药合用可加重神经系统的毒性。

长春碱 Vinblastine

(1)本品与丝裂霉素同用会导致急性呼吸窘迫及肺浸润。(2)合用其他有降低白细胞的药物时应减量。(3)与别嘌醇、秋水仙碱或丙磺舒合用,可升高血尿酸浓度。

长春瑞滨 Vinorelbine

(1)禁止与苯妥英钠或黄热病疫苗合用。(2)不宜与减毒活疫苗、伊曲康唑、丝裂霉素合用。(3)与环孢素、他克莫司合用应谨慎。

长春新碱 Vincristine

(1)与伊曲康唑合用增加肌肉神经系统的不良反应。(2)与苯妥英钠合用,降低苯妥英钠的吸收或代谢亢进。(3)与铂类抗肿瘤药合用,可能增强第8对脑神经障碍。(4)与L-天冬酰胺酶合用,可能增强神经系统及血液系统障碍。(5)本品可阻止甲氨蝶呤从细胞内渗出,提高后者的细胞内浓度,故先注射本品,再用甲氨蝶呤。

肠内营养乳剂(TP)

Enteral Nutritional Emulsion (TP)

本品含维生素K,可能与香豆素类抗凝药有相互作用。

重组人促红素

Recombinant Human Erythropoietin

(1)降低抗高血压药物作用,因本品有升高血压作用,尤其在血细胞比容迅速提高时。(2)本品可使红细胞数量增多,血液易于凝固,同时接受血液透析的患者肝素用量应相应增加。(3)铝剂摄入过多可影响治疗效果。

重组人粒细胞集落刺激因子

Recombinant Human Granulocyte Colony-stimulating Facotor

与促进白细胞释放的药物(如锂盐)应慎用。

重组人粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子

Recombinant Human Granulocyte Macrophage Colony Stimulating Factor

(1)与化疗药同时使用,可加重骨髓毒性,因而除白血病外不宜与化疗药物同时使用,应于化疗结束后24～48小时使用。(2)本品可引起血浆白蛋白降低,因此,同时使用具有血浆白蛋白高结合的药物应注意调整药物的剂量。

重组人生长激素 Recombinant Human Somatropin (Recombinant Human Growth Hormone)

同时使用糖皮质激素可能抑制激素的反应,故在生长激素治疗中糖皮质激素用量通常不得超过相当10～15 mg氢化可的松/平方米体表面积。同时使用非雄激素类固醇可进一步增进生长速度。

雌莫司汀 Estramustine

(1)有报道,雌激素可能通过抑制代谢而增加三环类抗抑郁药的疗效和毒性。(2)牛奶、奶制品及含钙、镁、铝的药物

可能影响本品的吸收。其机制为雌二醇氮芥与多价的金属离子可形成不溶性的盐。(3) 磷酸雌莫司汀可能增加 ACE 抑制药血管神经性水肿的发生率。

醋氯芬酸 Aceclofenac

(1) 非甾体抗炎药 (NSAIDs) 可抑制甲氨蝶呤在肾小管分泌，可能具有轻微的代谢相互作用，而致甲氨蝶呤清除率降低，因此在高剂量甲氨蝶呤治疗期间，应始终避免服用 NSAIDs。某些 NSAIDs 可抑制锂盐在肾脏的消除过程，导致血清锂浓度升高，除非血清钾水平可以经常进行测定，应避免与钾盐合用。NSAIDs 可抑制血小板聚集和损害胃肠道黏膜，可增加抗凝血药的活性，增加使用抗凝血药患者的胃肠道出血的风险，除非可以进行密切的监测。醋氯芬酸应避免与香豆素类口服抗凝血药、噻氯匹定、溶解血栓剂及肝素合用。(2) 以下联合用药需调整剂量或注意：当使用低剂量甲氨蝶呤时，也应注意 NSAIDs 与甲氨蝶呤之间产生药物相互作用的可能，特别是肾功能不全患者，如果在 24 小时内同时使用 NSAIDs 与甲氨蝶呤，应警惕，因为甲氨蝶呤血浆药物浓度可能增加而致毒性增加。NSAIDs 与环孢素或他克莫司合用，由于降低肾脏前列腺合成，肾毒性风险增加，因此在联合治疗时应密切监测肾功能。同时服用阿司匹林和其他非甾体抗炎药会增加不良反应发生率。非甾体抗炎药物会削弱呋塞米和布达他尼的利尿作用。可能的作用机制是抑制前列腺素合成，同样它们也会降低噻嗪类利尿药的降压作用。与保钾利尿药同时使用会升高钾水平，因此应监测血钾。同时应用非甾体抗炎药和 ACEI，会增加失水者急性肾衰竭的危险。尽管不能排除与其他抗高血压药如 β-受体阻断药的相互作用，但醋氯芬酸与苄氟噻嗪合用未发现影响其对血压的控制作用。醋氯芬酸可能会引起低血糖，使用时应考虑调整降糖药物的剂量。轻、中度肾功能不全者单剂量服药后，药动学未观察到临床意义上的差异。(3)醋氯芬酸主要通过 CYP2C9 代谢，因此可能有与苯妥英钠、地高辛、西咪替丁、甲苯磺丁脲、保泰松、胺碘酮、咪唑和磺胺苯吡唑发生相互作用的风险。同 NSAIDS 类其他药品一样，与通过肾消除的药物，如甲氨蝶呤和锂盐，也存在药物相互作用的风险，但醋氯芬酸实际上完全与血浆蛋白结合，随之会与其他高蛋白结合药物发生置换作用，必须注意。

醋酸去氨加压素

Desmopressin Acetate

(1) 与已知可导致抗利尿激素分泌异常综合征的药物（如三环类抗抑郁药、选择性 5- 羟色胺再摄取抑制药、氯丙嗪、卡马西平）合用，可加强抗利尿作用引致体液潴留危险性升高。(2) 合用洛哌丁胺将导致本品血浓度升高 3 倍，增加水潴留／低钠血症危险。(3) 合用二甲硅油可能会降低本品的吸收。(4) 食用高脂肪饮食可使本品吸收率降低。

达肝素 Dalteparin

对止血有影响的药物（如溶栓药，阿司匹林，非甾体抗炎药，维生素 K 拮抗药，葡聚糖）可能加强本品的抗凝作用。

达卡巴嗪 Dacarbazine

本品与其他有骨髓抑制作用的药物或放疗合用应减量。

达那唑 Danazol

(1) 与胰岛素同用时，易产生耐受性。(2) 与华法林并用时抗凝增效，易发生出血。(3) 与糖皮质激素有协同作用，与泼尼松合用可减少泼尼松用量。

大观霉素 Spectinomycin

与氟喹诺酮类药联用，可增强疗效。

氮䓬斯汀 Azelastine

(1) 避免与乙醇或其他神经中枢系统抑制药物同用，以免加重神经中枢系统抑制，导致眩晕、嗜睡。(2) 同服西咪替丁可使本品的生物利用度提高。

地尔硫䓬 Diltiazem

(1) 肾上腺素 β 受体拮抗药：可能出现窦房传导阻滞，房室传导阻滞和心动

过缓。避免两者在相近时间内同时静脉给予。(2) 西咪替丁：使本品作用增强。(3) 麻醉药：可增强本品的心脏抑制和降压作用。(4) 利福平：可使本品作用减弱。(5) 环孢素：本品可增加环孢素的血浆药物浓度。(6) 硝苯地平：增加本品的血浆药物浓度，使本品作用增强。(7) 地高辛：本品可增加地高辛的血浆药物浓度。(8) 苯二氮䓬：本品可明显增加三唑仑和咪达唑仑血浆峰浓度并延长其消除半衰期。(9) 卡马西平：本品可使卡马西平的血浆药物浓度增高而导致毒性。

地氟烷　Desflurane

苯二氮䓬或阿片类镇痛药合用应减少本品剂量，氧化亚氮可减少本品的MAC；本品可增强非去极化肌松药（如泮库溴铵）的神经肌肉阻滞效应。

地高辛　Digoxin

(1) 排钾利尿药、皮质激素、两性霉素B：可能引起低钾血症而致洋地黄中毒。(2) 抗酸药、新霉素、柳氮磺吡啶、阴离子交换树脂（考来烯胺）：可抑制本品吸收而导致作用减弱。(3) 肾上腺素β受体拮抗药：可能导致房室传导阻滞及心动过缓。(4) 维拉帕米、地尔硫䓬、胺碘酮减少本品的清除，可能导致房室传导阻滞及心动过缓。(5) 螺内酯：延长本品半衰期，需调整剂量或给药间隔，并监测血浆药物浓度。(6) 血管紧张素转换酶抑制药、血管紧张素受体Ⅱ拮抗药：使本品血浆药物浓度增高。(7) 肝素：地高辛可能部分抵消肝素的抗凝作用。(8) 甲氧氯普胺：促进肠道运动而减少本品生物利用度。(9) 溴丙胺太林：抑制肠道蠕动而提高本品的生物利用度。(10) 环孢素：使本品的血浆药物浓度增加而可能导致中毒。(11) 硫酸镁：洋地黄化时静脉应用硫酸镁可发生心脏传导阻滞，尤其是同时静注钙盐时。

地喹氯铵　Dequalinium Chloride

如与其他药物同时使用可能会发生药物相互作用，详情请咨询医师或药师。

地氯雷他定　Desloratadine

与其他抗交感神经药或有中枢神经系统镇静作用的药合用会增强睡眠作用。

地奈德　Desonide

肝药酶诱导药，如苯巴比妥、苯妥英钠等可使糖皮质激素的代谢速度加快。

地诺前列酮　Dinoprostone

· 与缩宫素联用缩宫素效果加强，应注意监测。

地塞米松　Dexamethasone

(1) 非甾体抗炎药可加强其致溃疡作用。(2) 本品可增强对乙酰氨基酚的肝毒性。(3) 与两性霉素B或碳酸酐酶抑制药合用，可加重低钾血症，长期与碳酸酐酶抑制药合用，易发生低血钙和骨质疏松。(4) 与蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。(5) 与抗胆碱能药（如阿托品）长期合用，可致眼压增高。(6) 三环类抗抑郁药可使其引起的精神症状加重。(7) 与降糖药如胰岛素合用时，因可使糖尿病患者血糖升高，应适当调整降糖药剂量。(8) 甲状腺激素可使其代谢清除率增加，故甲状腺激素或抗甲状腺药与其合用，应适当调整后者的剂量。(9) 与避孕药或雌激素制剂合用，可加强其治疗作用和不良反应。(10) 与强心苷合用，可增加洋地黄毒性及心律失常的发生。(11) 与排钾利尿药合用，可致严重低钾血症，并由于水钠潴留而减弱利尿药的排钠利尿效应。(12) 与麻黄碱合用，可增强其代谢清除。(13) 与免疫抑制药合用，可增加感染的危险性，并可能诱发淋巴瘤或其他淋巴细胞增生性疾病。(14) 可增加异烟肼在肝脏的代谢和排泄，降低异烟肼的疗效。(15) 可促进美西律在体内代谢，降低血浆药物浓度。(16) 与水杨酸盐合用，可减少血浆水杨酸盐的浓度。(17) 与生长激素合用，可抑制后者的促生长作用。(18) 与巴比妥类、苯妥英钠、利福平合用，本品代谢促进，作用减弱。(19) 可减弱抗凝药作用，应调整剂量。

地西泮 Diazepam

（1）与易成瘾或可能成瘾药合用，成瘾的危险性增加。（2）饮酒及与全麻药、可乐定、镇痛药、单胺氧化酶抑制药和三环抗抑郁药合用，可彼此相互增效。（3）阿片类镇痛药的用量至少应减至1/3。而后按需逐渐增加。（4）与抗酸药合用可延迟氯氮䓬和地西泮的吸收。（5）与抗高血压药或利尿抗高血压药合用时，可使本类药的降压增效。（6）与钙离子通道拮抗药合用时，可能使低血压加重。（7）与西咪替丁合用时可使清除减慢，血浆药物浓度升高，但对劳拉西泮可无影响。（8）普萘洛尔与苯二氮䓬类抗惊厥药合用时可导致癫痫发作的类型和（或）频率改变，应及时调整剂量，包括普萘洛尔在内的血浆药物浓度可能明显降低。（9）卡马西平与硝西泮合用，可使其清除半衰期缩短。（10）与扑米酮合用，由于药物代谢的改变，可能引起癫痫发作类型改变，需调整扑米酮的用量。（11）与左旋多巴合用时，可降低后者的疗效。（12）本品与苯妥英钠合用可减慢后者的代谢，血药浓度增加。与利福平合用时浓度可使其血药浓度降低。

地衣芽胞杆菌制剂

Bacillus Licheniformobiogen

与抗菌药物合用有可能降低本品疗效；铋剂、鞣酸、药用炭能抑制、吸附活菌，不能并用。

丁卡因 Tetracaine

（1）不宜同时服用磺胺药。（2）与其他局麻药合用时，本品应减量。（3）本品可与肾上腺素合用，其作用使血管收缩、血流量减少、药物吸收减慢、作用持续时间延长等。（4）本品可增强顺式阿曲库铵的神经阻滞作用，合用时应降低后者用量。

丁螺环酮 Buspirone

（1）与乙醇和其他中枢抑制药合用，可使中枢抑制作用增强。（2）与氟哌啶醇合用可使后者血药浓度升高，引起锥体外系反应。（3）与氟西汀、氟伏沙明和大剂量曲唑酮合用，可能引起5-HT综合征。（4）与单胺氧化酶抑制药合用可使血压升高。（5）与地高辛合用可升高后者血浆浓度。（6）与环孢素合用可升高后者血浓度，引起肾脏不良反应。（7）红霉素、唑类抗真菌药等CYP3A4抑制药可使本品血浆半衰期延长，AUC增大。

丁溴东莨菪碱

Scopolamine Butylbromide

注射给药时，三环类抗抑郁药、奎尼丁及金刚烷胺可增强本品的抗胆碱作用。

毒毛花苷K Strophanthin K

（见地高辛）

度洛西汀 Duloxetine

（1）与强CYP2D62抑制药合并使用时，度洛西汀的血药浓度将会增加。（2）度洛西汀与血浆蛋白高度结合，正接受其他高血浆蛋白结合药物治疗的患者，服用度洛西汀时，可能会增加其他药物的游离浓度，由此可能导致发生药品的不良反应。（3）度洛西汀是CYP2D62中度抑制药，能够增加经CYP2D6代谢药物的AUC和C_{max}，因而联合使用度洛西汀和其他主要经该酶代谢，并且治疗剂量范围狭窄的药物时，应该谨慎。

对氨水杨酸钠 Sodium Aminosalicylate

（1）与异烟肼合用可加强异烟肼的疗效。与利福平合用时，可干扰利福平自消化道吸收，不宜同时并用，如确需联合应用两者需间隔6小时。（2）本品可加强香豆素类抗凝药、某些抗癫痫药、抗高血压药、抗胆碱药、三环类抗抑郁药的作用。（3）与硫唑嘌呤或巯嘌呤合用可增加白细胞减少的风险。（4）禁与水杨酸类药合用，以减少对胃肠的刺激。（5）抗痛风药丙磺舒可使本品的排出减少，血浆浓度增加1倍。（6）本品可影响维生素B_{12}的吸收，对服用对氨水杨酸钠者其维生素B_{12}的需要量应予增加。

对乙酰氨基酚 Paracetamol

(1) 应用巴比妥类（如苯巴比妥）或抗胆碱药（如颠茄）的患者，长期使用本品时可致肝损害。(2) 本品与氯霉素同用时可增强后者的毒性。(3) 与丙磺舒合用，本品的血浆药物浓度升高、半衰期延长，疗效增强，但不良反应也相应增加。(4) 碳酸氢钠可加快本品的吸收。(5) 与口服降糖药（醋磺己脲、氯磺丙脲、格列齐特、格列美脲、格列吡嗪、格列喹酮、格列本脲、妥拉磺脲、甲苯磺丁脲）合用，可增加低血糖的风险。(6) 与醋硝香豆素、双香豆素、苯丙香豆素、茴茚二酮、苯茚二酮、阿地肝素、舍托肝素、达肝素、依诺肝素、那屈肝素钙、帕肝素钠、利维肝素、亭扎肝素钠、华法林、西酞普兰、氯吡格雷、氯伏胺、依替巴肽、非莫西汀、氟西汀、帕罗西汀、氟辛克生、氟伏沙明、奈法唑酮、舍曲林、文拉法辛、肝素合用，可增加出血的风险。(7) 本品可升高甲氨蝶呤的血浆药物浓度，从而增强其毒性（白细胞减少、血小板减少、贫血、中毒性肾损害和黏膜溃疡形成）。(8) 本品可增加环孢素中毒（肾功能不全、胆汁淤积、感觉异常）的风险。(9) 与达那帕特合用可增加出血和椎管内麻醉时血肿发生的风险。(10) 本品可抑制锂盐、钾随尿液排泄，使锂、钾的血浆药物浓度升高。(11) 与含镁、铝的药物合用时本品吸收率降低。(12) 本品可减弱阿米洛利、坎利酸钾、螺内酯、氨苯蝶啶的利尿作用，导致高钾血症或潜在的中毒性肾损害。(13) 本品可减弱阿拉普利、贝那普利、卡托普利、西拉普利、地拉普利、依那普利拉、马来酸依那普利、福辛普利、咪达普利、赖诺普利、莫昔普利、喷托普利、培哚普利、喹那普利、雷米普利、螺普利、替莫普利、群多普利、佐芬普利、阿佐塞米、呋塞米、托拉塞米、布美他尼、依他尼酸、贝美噻嗪、苄氟噻嗪、苄噻嗪、布噻嗪、氯噻嗪、环戊噻嗪、环噻嗪、氢氯噻嗪、氢氟噻嗪、甲氯噻嗪、伯利噻嗪、三氯噻嗪、氯噻酮、氯帕胺、吲达帕胺、希帕胺、美托拉宗、吡咯他尼、喹乙宗的降压和利尿作用。(14) 本品可减弱 β 受体拮抗药（醋丁洛尔、阿替洛尔、倍他洛尔、贝凡洛尔、比索洛尔、布新洛尔、卡替洛尔、卡维地洛、塞利洛尔、地来洛尔、艾司洛尔、拉贝洛尔、左布诺洛尔、甲吲洛尔、美替洛尔、美托洛尔、纳多洛尔、奈必洛尔、氧烯洛尔、喷布洛尔、吲哚洛尔、普萘洛尔、索他洛尔、他林洛尔、特他洛尔、噻吗洛尔）的抗高血压作用。(15) 与氨氯地平、非洛地平、伊拉地平、拉西地平、美尼地平、尼卡地平、硝苯地平、尼伐地平、尼莫地平、尼索地平、尼群地平、普尼地平、地尔硫䓬、氟桂利嗪、利多氟嗪、戈洛帕米、维拉帕米合用，可减弱后者的降压作用，并增加胃肠道出血的风险。(16) 与其他非甾体类抗炎药合用，胃肠道的不良反应增多，并有致溃疡发作的危险。(17) 与 β-葡聚糖合用可导致严重的胃肠道损害。(18) 与他克莫司合用可导致急性肾衰竭。(19) 与左氧氟沙星、氧氟沙星合用可增加癫痫发作的风险。(20) 不得与乙醇或含有乙醇的饮料同服。

多巴胺 Dopamine

(1) 硝普钠、异丙肾上腺素、多巴酚丁胺：注意心排血量的改变，与单用本品时反应不同。(2) α 受体拮抗药：与酚苄明、酚妥拉明、妥拉唑林等同用，后者的扩血管效应可被本品的外周血管的收缩作用拮抗。(3) 全麻药：尤其与环丙烷或卤代碳氢化合物合用可引起室性心律失常。(4) 肾上腺素 β 受体拮抗药：可拮抗本品对心脏的 β_1 受体作用。(5) 硝酸酯类：可减弱硝酸酯的抗心绞痛及多巴胺的升压效应。(6) 利尿药：可增加利尿作用。(7) 三环类抗抑郁药：可引起心律失常、心动过速。(8) 单胺氧化酶抑制药：可延长及加强多巴胺的效应。

多巴酚丁胺 Dobutamine

(1) 全麻药：尤其与环丙烷、氟烷等同用，室性心律失常发生的可能性增加。(2) 肾上腺素 β 受体拮抗药：可使外周血管的总阻力加大。(3) 硝普钠：可导致心排血量微增，肺楔压略降。

多巴丝肼 Levodopa and Benserazide

(1) 与抗抑郁药、阿片类药和利血平

合用可抑制本品。(2) 与非选择性单胺氧化酶抑制药合用可致高血压危象。(3) 与拟交感神经药合用可加强左旋多巴的作用。(4) 与维生素 B_6 合用可提高疗效。(5) 高蛋白饮食可影响本品吸收。

多酶片 Muitienzyme Tablets

(见胰酶、胃蛋白酶)

多奈哌齐 Donepezil

(1) 与抑制 CYP3A4 或 CYP2D6 的药物合用，本品的血浓度增加。(2) 与药酶诱导剂合用，本品的血浓度降低。

多黏菌素 Polymyxin

(1) 顺铂与氨基苷类合用本品肾毒性增加；替考拉宁、两性霉素 B、环孢素、万古霉素增加本品的肾毒性。(2) 多黏菌素类与两性霉素 B 合用增加肾毒性发生的危险。(3) 多黏菌素与襻利尿药合用增加耳毒性。(4) 多黏菌素增强非去极化肌松药和氯琥珀胆碱的作用。(5) 多黏菌素可能使雌激素类的避孕作用减弱（危险性可能较小)。(6) 多黏菌素类拮抗新斯的明、吡斯的明的作用。

多潘立酮 Domperidone

(1) 与红霉素、甘露醇联用可提高疗效。(2) 解痉药减弱本品作用。(3) 降低胃黏膜保护药、助消化药疗效。(4) H_2 受体拮抗药减少本品吸收。(5) 维生素 B_6 可减轻本品引起泌乳的不良反应。(6) 锂盐和地西泮类药联用时可引起锥体外系症状，如运动障碍等。

多柔比星 Doxorubicin

(1) 各种抗癌药物特别是亚硝脲类、大剂量环磷酰胺或甲氨蝶呤、丝裂霉素或放射治疗，如与多柔比星同用，均应酌减剂量。(2) 链佐星可延长多柔比星的半衰期，因此剂量应酌减。(3) 任何可能导致肝脏损害的药物如与本品同用，可增加多柔比星的肝毒性。(4) 与阿糖胞苷同用可导致坏死性结肠炎。(5) 与环磷酰胺、氟尿嘧啶、甲氨蝶呤、顺铂以及亚硝脲类同用，有不同程度的协同作用。(6) 用药期间慎用活病毒疫苗接种。

多塞平 Doxepin

(1) CYP 抑制药可抑制本品的代谢，使血浓度增加，引起不良反应。(2) CYP 诱导药可增强本品的代谢，使血浓度降低，影响药物疗效。(3) 本品可降低抗凝药（如双香豆素、华法林）的代谢，增加出血的危险。(4) 与乙醇合用，可加重中枢神经的抑制作用。(5) 与抗癫痫药合用，可降低癫痫阈值，从而降低抗癫痫药的作用。(6) 与雌激素或含雌激素的避孕药合用，可增加本品的不良反应，同时降低抗抑郁作用。(7) 与单胺氧化酶抑制药合用，可引起 5-HT 综合征。(8) 与肾上腺素受体激动药合用，可引起严重高血压与高热。(9) 与甲状腺制剂合用，可相互增效，导致心律失常。(10) 与苯海拉明合用，可增加抗胆碱能作用的不良反应。

多沙普仑 Doxapram

(1) 与咖啡因、哌甲酯、匹莫林、肾上腺素受体激动药等合用，可出现紧张、激动、失眠甚至惊厥或心律失常。(2) 与单胺氧化酶抑制药丙卡巴肼以及升压药合用时，可使血压明显升高。

多沙唑嗪 Doxazosin

(1) 非甾体抗炎药：同用可减弱降压作用，可能引起水钠潴留。(2) 其他抗高血压药：同用时降压作用增强，需调整剂量。(3) 雌激素：合用时由于体液潴留而增高血压。(4) 拟交感胺类：合用可使本品升压作用与拟交感胺类药物降压作用均减弱。(5) 血浆中大部分 (98%) 多沙唑嗪与蛋白结合，注意与其他蛋白结合率高的药物发生相互作用。

多索茶碱 Doxofylline

(1) 与氟喹诺酮类药物如依诺沙星、环丙沙星合用，宜减量。(2) 本品不得与其他黄嘌呤类药物同时服用，不可同时饮用含咖啡因的饮料或食品。

多糖铁复合物 Iron Polysaccharide Complex

抗酸剂及四环素抑制其吸收。

多西环素 Doxycycline

(1) 卡马西平、巴比妥钠促进本品代谢；苯妥英钠、扑米酮促进本品的代谢。(2) 多西环素可能使环孢素的血浆药物浓度升高。(3) 多西环素或四环素增加甲氨蝶呤的毒性。(4) 硫酸亚铁可明显影响本品的吸收。

多西他赛 Docetaxel

本品与多柔比星联用清除率增加。

厄贝沙坦 Irbesartan

(见氯沙坦)

厄多司坦 Erdosteine

服药期间，应避免同服强力镇咳药、能使支气管分泌物减少的药物。

厄洛替尼 Erlotinib

(1) 与 CYP3A4 抑制药,如阿扎那韦、克拉霉素、茚地那韦、伊曲康唑、奈法唑酮、奈非那韦、利托那韦、沙奎那韦、泰利霉素和伏立康唑等同用时应慎重。(2) 利福平、利福布汀、利福喷汀、苯妥英钠、卡马西平、苯巴比妥和圣约翰草等可使本品 AUC 下降 2/3。

厄他培南 Ertapenem

厄他培南可能使丙戊酸盐的血浆药物浓度降低。

恩氟烷 Enflurane

可加强非去极化肌松药的作用，所以合用时肌松药的剂量应减小。在使用恩氟烷的同时，经皮下、表面浸润或注射肾上腺素可导致心律失常，所以这种情况下应尽量避免静脉使用肾上腺素。避免同时合用恩氟烷和三环类抗抑郁药，尤其是患者有惊厥史、需要过度通气或需要使用大剂量麻醉药时。

恩他卡朋 Entacapone

(1) 与司来吉兰（选择性的 MAO-B 抑制药）联合使用，需调整本品剂量。(2) 与异丙肾上腺素、肾上腺素、去甲肾上腺素、多巴胺、多巴酚丁胺、甲基多巴和阿朴吗啡合用时，要监测心功能。(3) 与氨苄西林、氯霉素、考来烯胺、丙磺舒、利福平、红霉素等合用，不良反应增加。(4) 本品在胃肠道能与铁形成螯合物，故本品和铁剂的服药间隔至少 2 ~ 3 小时。

二氮嗪 Diazoxide

(1) 肾上腺素 β 受体阻滞药：可防止本品引起的反射性心动过速。(2) 利尿药：与呋塞米、噻嗪类等合用可增强降压作用，但升高血糖和血尿酸的作用也增强，须调整用量。(3) 口服抗凝药：合用可使抗凝作用加强，应调整剂量。(4) 其他抗高血压药：合用可加强降压作用而发生低血压，应调整剂量及监测血压。

二甲双胍 Metformin

(1) 与噻嗪类药物或其他利尿药、糖皮质激素、雌激素、口服避孕药、苯妥英钠、烟酸、拟交感神经药、钙通道阻滞药和异烟肼等合用时可引起血糖升高。(2) 与呋塞米合用，本品的 AUC 增加，但肾清除率无变化；同时呋塞米的 C_{max} 和 AUC 均下降，终末半衰期缩短，肾清除无改变。(3) 与西咪替丁合用可增加本品生物利用度，减少肾脏清除率。(4) 本品可增加华法林的抗凝作用。(5) 与树脂类药物合用，可减少本品的吸收。

二羟丙茶碱 Diprophylline

(1) 与锂盐合用，可使锂的肾排泄增加，影响锂盐的作用。(2) 与咖啡因或其他黄嘌呤类药并用，可增加其作用和毒性。

二氧丙嗪 Dioxopromethazine

与抗高血压药合用时有协同作用。与三环类抗抑郁药合用，可使两者的血浆药物浓度均增加。

伐地那非 Vardenafil

（1）与 α 受体拮抗药同服可能导致症状性低血压。故服用 α 受体拮抗药 6 小时内不能服用伐地那非。（2）本品可能增强硝酸类药物的降压效果。（3）HIV 蛋白激酶抑制药：两者都是 CYP3A4 抑制药，避免同时使用。

法罗培南 Faropenem

（1）与亚胺培南－西司他丁钠合用，西司他丁钠可抑制本品代谢，使本品的血浆药物浓度升高。（2）与呋塞米合用，可致肾毒性增强。（3）碳青霉烯类药如美罗培南、帕尼培南、亚胺培南等并用可使丙戊酸血浓度降低，导致癫痫复发。

法莫替丁 Famotidine

（1）抗痛风药可提高本品的血药浓度。（2）可影响抗生素等多种药物的药动学。

放线菌素 D Dactinomycin

本品可降低维生素 K 的效价。

非格司亭 Filgrastim

（1）抗肿瘤药由于迅速增殖分化的造血细胞对化疗药敏感，有可能影响本品的疗效，不宜与抗肿瘤药联合应用，须在停用化疗药 1 ～ 3 日给予本品。（2）本品不宜与抗肿瘤药联合应用，须在化疗停止后 1 ～ 3 日应用；与氟尿嘧啶合用可能加重中性粒细胞减少症。

非洛地平 Felodipine

（1）西咪替丁：抑制本品代谢，可能使本品作用增强。（2）抗癫痫药物（苯妥英钠、卡马西平、苯巴比妥）促进本品代谢，作用减弱。（3）其他抗高血压药：使本品降压作用增强。

非诺贝特 Fenofibrate

（1）香豆素类：本品可明显增强口服抗凝药的作用。（2）磺酰脲类降糖药：本品可增强磺酰脲类降糖药的作用。（3）苯妥英钠：本品可增强苯妥英钠的作用。（4）呋塞米：本品可增强呋塞米的作用。（5）羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药（他汀类药）：增加肌痛、横纹肌溶解等肌病的发生，应尽量避免联合使用。（6）胆汁酸结合树脂：可影响本品的吸收，至少应在服用这些药物之前 1 小时或之后 4 ～ 6 小时再服用本品。（7）环孢素：本品可增加环孢素导致肾功能损害的危险。

非索非那定 Fexofenadine

（1）与抗酸药一起服用，使非索非那定的药－时曲线下面积降低 41%、血浆峰浓度降低 43%。（2）不应与铝、镁抗酸剂同时服用。

芬太尼 Fentanyl

（1）本品与中枢抑制药，如催眠镇静药、抗精神病药、其他麻醉性镇痛药以及全麻药等有协同作用，合用时应慎重并适当调整剂量。（2）本品与 70% 氧化亚氮合用，可诱发心率减慢、心肌收缩力减弱、心排血量减少，左心室功能欠佳者尤其明显。（3）禁止与单胺氧化酶抑制药合用。

酚苄明 Phenoxybenzamine

（1）拟交感胺类：升压效应减弱或消失。（2）胍乙啶：易发生直立性低血压。（3）二氮嗪：合用时具有拮抗二氮嗪抑制胰岛素释放的作用。（4）α、β 受体激动药：如肾上腺素合用可导致严重低血压。

酚磺乙胺

（1）右旋糖苷：可抑制血小板聚集而拮抗本品的止血作用。（2）促凝血药：与氨甲苯酸、维生素 K 等促凝血药合用可增强止血效果。（3）与氨苄西林－舒巴坦、硝普钠配伍可降低疗效。

酚酞 Phenolphthalein

酚酞可干扰酚磺酞排泄试验（PSP），使尿色变成品红或橘红色，同时酚磺酞排泄加快；本品与碳酸氢钠、氧化镁等碱性药物合用，可引起尿液变色。

酚妥拉明 Phentolamine

（1）拟交感胺类药：使拟交感胺类药的周围血管收缩作用抵消或减弱。（2）二

氮嗪：使二氮嗪抑制胰岛素释放的作用受抑制。(3) 镇静催眠药（苯巴比妥、格鲁米特、甲喹酮等）：能加强本品的降压作用。(4) 利血平：能加强本品的降压作用。(5) 强心苷：可使其毒性反应增强。(6) 铁剂：忌与铁剂合用。(7) 硝酸甘油：禁与硝酸甘油类药合用。

奋乃静 Perphenazine

(1) 本品与乙醇或中枢神经抑制药及抗胆碱药合用时，可彼此增效。(2) 本品与苯丙胺类药合用时，后者的效应可减弱。(3) 本品与抗酸药或止泻药合用，可降低口服吸收。(4) 本品与肾上腺素合用，可导致明显的低血压和心动过速。(5) 本品与单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药合用时，两者的抗胆碱作用可相互增强并延长。(6) 本品与胍乙啶合用时，后者的降压效应可被抵消。(7) 本品与左旋多巴合用时，后者可抑制前者的抗震颤麻痹效应。

呋塞米 Furosemide

(1) 糖皮质激素、促糖皮质激素、雌激素、NSAID、拟交感神经药、抗惊厥药降低本品利尿作用。(2) 氯贝丁酯、多巴胺、乙醇增强本品利尿或降压作用。(3) 合用抗痛风药应减小抗痛风药剂量。(4) 本品可降低降糖药、抗凝药和抗纤溶药的作用。(5)增强非去极化肌松药的作用。(6) 与磺胺类、两性霉素 B、头孢菌素、氨基苷类抗生素合用，耳毒性和肾毒性增加。(7) 与抗组胺药合用耳毒性增加。(8) 与锂盐合用肾毒性增加。(9) 与水合氯醛合用导致分解代谢增强。(10) 与碳酸氢钠合用易发生低氯性碱中毒。(11) 巴比妥类药物、麻醉药：易引起直立性低血压。(12) 吲哚美辛和苯妥英钠可降低呋塞米的利尿作用。

伏格列波糖 Voglibose

(1) 服药期间，由于结肠内糖类酵解增加，蔗糖或含蔗糖的食物常会引起腹部不适，甚至导致腹泻。(2) 与磺酰脲类、二甲双胍或胰岛素合用，可能会出现低血糖，故需减少那些降糖药的剂量。(3) 个别情况下会影响地高辛的生物利用度，需调整地高辛剂量。(4) 避免与考来酰胺、肠道吸附剂和消化酶类制剂合用，以免影响本品的疗效。

氟比洛芬 Flurbiprofen

(1) 与洛美沙星、诺氟沙星、依诺沙星合用，有导致抽搐发生的可能。(2) 慎与双香豆素类抗凝药（华法林等）、甲氨蝶呤、锂盐、噻嗪类利尿药、襻利尿药、氟喹诺酮类抗菌药、糖皮质激素类药物合用。

氟达拉滨 Fludarabine

不推荐与喷司他丁合用，因可能出现致命的肺毒性。双嘧达莫及其他腺苷抑制药可减弱本品的疗效。

氟伐他汀 Fluvastatin

免疫抑制药、苯扎贝特、吉非贝齐或烟酸：合用时发生肌病的风险增加。

氟奋乃静 Fluphenazine

(1) 本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢抑制作用加强。(2) 本品与抗高血压药合用易致直立性低血压。(3) 本品与舒托必利合用，有发生室性心律失常的危险，严重者可致尖端扭转性心律失常。(4) 本品与阿托品合用，不良反应加重。(5) 本品与锂盐合用，可引起脑损害、锥体外系反应、运动障碍等。(6) 本品与三环类抗抑郁药合用，毒性和抗胆碱能作用均增加。(7) 本品与氟西汀、帕罗西汀合用，可使帕金森病的病情恶化。

氟伏沙明 Fluvoxamine

(1) 与乙醇合用，可加强中枢抑制作用。(2) 本品能抑制 CYP1A2 的活性，因此与 CYP1A2 代谢有关的药物合用时，需注意药物引起的不良反应。(3) 锂可加重本品的 5-HT 能作用。(4) 与能增强 5-HT 能神经功能的药物（如氯米帕明、阿米替林、丙米嗪、苯丙胺、芬氟拉明）合用时，可导致 5-HT 综合征。(5) 与苯二氮䓬类药合用可升高本品的血浓度。(6) 与奎尼丁合用能增强心脏毒性，引

起室性心律失常、低血压、心力衰竭等。(7) 吸烟可增加本品代谢，需适当增加剂量。(8) 可增加三环类抗抑郁药原有的血浆浓度，建议不与三环类抗抑郁药同时应用。(9) 可提高普萘洛尔的血浆水平，同服时建议减少普萘洛尔的剂量。(10) 与华法林合用2周，可增加华法林的血浆浓度和凝血时间，患者在口服抗凝药和氟伏沙明时，应监测凝血时间并相应调整氟伏沙明剂量。

氟桂利嗪 Flunarizine

(1) 与催眠药或镇静药合用，可加强镇静作用。(2) 与胺碘酮合用，可使心动过缓、房室传导阻滞等病情的加重。(3) 与β肾上腺素受体拮抗药合用，可引起低血压、心动过缓和房室传导阻滞。(4) 与卡马西平合用，可降低本品的血浆浓度。(5) 与NSAID或口服抗凝药合用，可增加胃肠道出血的危险。(6) 与苯妥英钠、利福平、苯巴比妥等合用，可降低本品的血浆浓度。

氟康唑 Fluconazole

(1) 异烟肼或利福平与氟康唑同用，可降低氟康唑的浓度，可导致治疗失败或感染复发。(2) 甲苯磺丁脲、氯磺丁脲和格列吡嗪与氟康唑同用时，上述降糖药血浆浓度升高，易发生低血糖。(3) 高剂量氟康唑与环孢素同用时，可使环孢素血浆药物浓度增高，致继发性毒性反应的危险增加。(4) 氢氯噻嗪可使氟康唑的血浆药物浓度增加。(5) 茶碱与氟康唑同用时血浆药物浓度增加，可导致毒性反应发生。(6) 华法林与氟康唑同用时可增强其抗凝作用。

氟喹诺酮类

(1) 氟喹诺酮类与非甾体抗炎药合用可能增加惊厥发生的危险性。(2) 建议环丙沙星作术前预防用药时避免与阿片类镇痛药合用（环丙沙星血浆药物浓度降低）。(3) 抗酸药减少氟奎诺酮类的吸收。(4) 莫西沙星与胺碘酮、丙吡胺、普鲁卡因胺合用增加室性心律失常的危险性，避免合用。(5) 莫西沙星与红霉素合用增加室性心律失常发生的危险性。(6) 氟喹诺酮类可能使香豆素类或苯茚二酮的抗凝作用增强。(7) 环丙沙星抑制度洛西汀的代谢；莫西沙星与三环类抗抑郁药合用增加室性心律失常。(8) 环丙沙星、诺氟沙星可能使格列本脲的作用增强。(9) 环丙沙星影响苯妥英钠的血浆药物浓度（升高或降低）。(10) 莫西沙星与咪唑斯汀合用增加室性心律失常发生。(11) 蒿甲醚／本芴醇避免与氟喹诺酮类合用；莫西沙星与氯喹、羟氯喹、甲氟喹及奎宁合用增加室性心律失常的发生。(12) 莫西沙星与氟哌啶醇、吩噻嗪、匹莫齐特及舍吲哚合用增加室性心律失常的发生；环丙沙星使氯氮平、奥氮平的血浆药物浓度升高。(13) 莫西沙星与阿托西汀合用增加室性心律失常的发生。(14) 莫西沙星与索他洛尔合用增加室性心律失常的发生。(15) 钙剂可抑制环丙沙星的吸收。(16) 氟喹诺酮类与环孢素合用肾毒性增强。(17) 环丙沙星可能抑制甲氨蝶呤的排泄。(18) 环丙沙星抑制罗匹尼罗的代谢。(19) 氟喹诺酮类可能抑制佐米曲普坦的代谢。(20) 铁剂可减少环丙沙星、左氧氟沙星、莫西沙星、诺氟沙星及氧氟沙星的吸收。(21) 环丙沙星使替扎尼定的血浆药物浓度升高。(22) 莫西沙星与羟乙基磺酸喷他脒合用增加室性心律失常的发生。(23) 丙磺舒可抑制环丙沙星及诺氟沙星的排泄。(24) 茶碱与氟喹诺酮类合用可能增加惊厥发生的危险性；环丙沙星及诺氟沙星使茶碱的血浆药物浓度升高。(25) 硫糖铝抑制环丙沙星、左氧氟沙星、莫西沙星、诺氟沙星及氧氟沙星的吸收。(26) 锌剂可减少环丙沙星、左氧氟沙星、莫西沙星、诺氟沙星及氧氟沙星的吸收。(27) 与抗酸药、矿物质、多种维生素同用时，会降低莫西沙星的吸收。与药用炭同时口服，能阻止80%的莫西沙星吸收。

氟尿嘧啶 Fluorouracil

(1) 多种药物可影响本品的抗癌作用或毒性，包括甲氨蝶呤、甲硝唑及四氢叶酸。与甲氨蝶呤合用，应先给甲氨蝶呤4～6小时再给予本品，否则会减效。

先给予四氢叶酸，再用本品可增加疗效。(2) 别嘌醇可减低本品的骨髓抑制作用。

氟哌噻吨　Flupentixol

(1) 本品可增加乙醇、巴比妥类及其他中枢抑制药的作用，并阻断胍乙啶的降压作用，减弱左旋多巴和肾上腺素类药物的作用。(2) 与甲氧氯普胺和哌嗪合用可增加锥体外系症状的发生率。

氟哌啶醇　Haloperidol

(1) 本品与乙醇或其他中枢神经抑制药合用，对中枢抑制作用增强。(2) 本品与苯丙胺合用，可降低后者的作用。(3) 本品与巴比妥或其他抗惊厥药合用时，可改变癫痫的发作形式，不能使抗惊厥药增效。(4) 本品与抗高血压药合用时，可产生严重的低血压。(5) 本品与抗胆碱药物合用时，有可能使眼压增高。(6) 本品与肾上腺素合用，可导致血压下降。(7) 本品与锂盐合用时，需注意观察神经毒性与脑损伤。(8) 本品与甲基多巴合用，可产生意识障碍、思维迟缓、定向障碍。(9) 本品与卡马西平合用可使本品的血药浓度降低，效应减弱。(10) 饮茶或咖啡可减低本品的吸收，降低疗效。

氟他胺　Flutamide

(1) 双香豆素乙酯、华法林与本品合用，凝血酶原时间延长，必须监测凝血酶原时间。(2) 本品与茶碱合用时会出现茶碱血浓度增加。(3) CYP1A2 是氟他胺转化成其活性物质 2- 羟基氟他胺的主要代谢酶，应注意其诱导剂或抑制药的并用。

氟替卡松　Fluticasone Propionate

同时服用 CYP3A4 抑制药如酮康唑、利托那韦时，可能提高丙酸氟替卡松的血浆药物浓度，作用增强。

氟西汀　Fluoxetine

(1) 与乙醇或中枢抑制药合用可使中枢抑制作用增强。(2) 与肝酶（主要是 CYP2D6）抑制药合用可增加本品的血浓度。(3) 与 CYP 诱导剂合用可降低本品的血药浓度。(4) 与其他三环类抗抑郁药合用，可使后者血浓度增加。(5) 与增强 5-HT 能神经功能的药物合用可引起 5-HT 综合征。

福莫司汀　Fotemustine

(1) 与苯妥英钠（为了预防某些抗肿瘤药诱发的惊厥时应用）有禁忌。(2) 应用多柔比星、柔红霉素、卡铂、顺铂、卡莫司汀、长春新碱、长春碱、博来霉素、甲氨蝶呤时，由于细胞增殖抑制药导致苯妥英钠在消化道吸收的减少，从而诱发惊厥的发作。可短时间与抗惊厥的苯二氮䓬类药合用。(3) 免疫抑制药如环孢素等可能引发过度的免疫抑制，导致淋巴细胞增生。(4) 当本品与大剂量达卡巴嗪在同一日应用时，偶尔会发生肺毒性，如急性成年人呼吸窘迫综合征。

辅酶 A　Coenzyme A

本药与三磷腺苷、细胞色素 C 等合用可增加疗效。

复方α-酮酸　Compound α-Keto Acid

(1) 氢氧化铝可加重或加速低磷血症。(2) 其他含钙药物、抗酸药：可加重高钙血症。(3) 四环素可影响本品的吸收。

复方地芬诺酯 Compound Diphenoxylate

(1) 本品可以增强巴比妥类、阿片类和其他中枢抑制药物的作用，不宜合用。(2) 本品可以减慢肠蠕动，可影响其他药物的吸收。

复方异丙托溴铵 Compound Ipratropium Bromide

(1) 同时使用黄嘌呤衍生物、β 肾上腺素能类和抗胆碱能类可增加不良反应。(2) 黄嘌呤衍生物、皮质类固醇和利尿药可增强由 β 受体激动药引起的低钾血症，对有严重气道阻塞的患者要特别重视。(3) 低钾血症可增加服用地高辛患者出现心律失常的危险，应监测血钾水平。(4) 同用 β 受体拮抗药可使支气管扩张效果显著降低。(5) 单胺氧化酶抑制药或

附录

三环类抗抑郁药可增强 β 肾上腺素能激动药的作用。(6) 吸入卤化烃类麻醉药如卤烷、三氯乙烯和安氟醚可以增加 β 受体激动药对心血管作用的易感性。

复方孕二烯酮 Compound Gestodene

(1) 可升高本品血浆药物浓度的药物：如阿伐他汀、维生素 C 及药酶抑制药如氟康唑等。三乙酰竹桃霉素与复方口服避孕药同时使用，可能会增加肝内胆汁淤积症的发生。(2) 可使本品避孕效果降低的药物：如抗菌药尤其是广谱抗菌药、药酶诱导药如利福平、苯巴比妥、苯妥英钠等。(3) 本品影响其他药物的疗效，使其作用减弱的有抗高血压药、抗凝药以及降血糖药；使其疗效增强的有三环类抗抑郁药。

复合消化酶胶囊

铝剂可影响本品吸收。

富马酸福莫特罗 Formoterol Fumarate

(1) 与其他拟交感神经药物合用会加重本品的不良反应。(2) 可能会引起低钾血症，合用黄嘌呤衍生物、类固醇药物和利尿药可能加强低血钾不良反应；而低血钾会增加使用洋地黄毒苷的患者发生心律失常的倾向。(3) 与奎尼丁、双异丙吡胺、普鲁卡因胺、吩噻嗪、抗组胺药（特非那定）、单胺氧化酶抑制药和三环类抗抑郁药合用会延长心电图 QT 间期，并增加发生室性心律失常的危险。(4) 合用左旋多巴、左甲状腺素、缩宫素和乙醇会降低心脏对本品的耐受性。(5) 与单胺氧化酶抑制药以及有相似作用的药物如呋喃唑酮和丙卡巴肼合用会加重高血压反应。

干酵母 Dried Yeast

本品不能与碱性药物合用，合用可破坏 B 族维生素。

干扰素 α-1b Interferon α-1b

使用本品时应慎用催眠药或镇静药。

干扰素 β-1a Interferon β-1a

(1) 与活疫苗或轮状病毒疫苗合用，可增加疫苗感染的危险性。(2) 已有干扰素降低人和动物的肝 CYP 酶活性的报道。当本品与治疗范围狭窄，并在很大程度上依赖肝 CYP 酶清除的药物，如抗癫痫药或某些类型的抗抑郁药合用时须谨慎。(3) 阿司匹林、吲哚美辛以及干扰前列腺素代谢的药物，可能降低干扰素的活性，应避免合用。(4) 本品可降低齐多夫定的清除率，增加齐多夫定的毒性，如嗜睡、疲劳、贫血等。

干扰素 γ Interferon γ

不能与抑制骨髓造血的药物同用。

甘草酸二铵 Diammonium Glycyrrhizinate

与利尿酸、呋塞米、乙噻嗪、三氯甲噻嗪等利尿药并用时，其利尿作用可增强本品所含甘草酸二铵的排钾作用，而导致血钾下降，应特别注意监测血钾。

甘露醇 Mannitol

可增加洋地黄毒性作用。

肝素 Heparin

(1) 与香豆素及其衍生物合用，可导致严重的凝血因子Ⅸ缺乏而出血。(2) 阿司匹林与 NSAID 胃肠道溃疡出血加剧。(3) 与双嘧达莫、右旋糖酐等合用，可能抑制血小板功能。(4) 糖皮质激素、促糖皮质激素等合用易诱发胃肠道溃疡出血。(5) 与依他尼酸、组织纤溶酶原激活物（t-PA）、尿激酶、链激酶等合用，可加重出血危险。(6) 与碳酸氢钠、乳酸钠等纠正酸中毒的药物合用可增强肝素的抗凝作用。(7) 与胰岛素合用，影响胰岛素与受体的结合，从而影响胰岛素的作用。(8) 甲巯咪唑、丙硫氧嘧啶：合用有协同作用。(9) 胰岛素：合用导致低血糖。(10) 鱼精蛋白：可中和本品作用。

高血糖素 Glucagon

除胰岛素外，未发现与其他药物发生作用。

格列本脲 Glibenclamide

本品通过 CYP2C9 代谢，故合用下述酶抑制药或诱导剂均会影响血糖水平。

(1) 合用下列药物可能导致低血糖发生：胰岛素、口服降糖药、水杨酸、对氨水杨酸、皮质激素、雄激素、氯霉素、香豆素类抗凝药、芬氟拉明、氯贝丁酯、ACE 抑制药、氟西汀、别嘌醇、抗交感神经药、环磷酰胺、异环磷酰胺、长效磺胺类、四环素族、单胺氧化酶抑制药、氟喹诺酮类、丙磺舒、咪康唑、己酮可可碱（胃肠外高剂量给药）、氟康唑等。(2) 合用下列药物可能升高血糖水平：雌激素和孕激素、噻嗪利尿药、促甲状腺激素、糖皮质激素、酚噻嗪及其衍生物、氯丙嗪、肾上腺素和其他拟交感神经药、烟酸（高剂量）及其衍生物、轻泻药（长期使用时）、苯妥英钠、高血糖素、巴比妥类、利福平、乙酰唑胺。(3) 与 H_2 受体拮抗药、β 受体拮抗药、可乐定和利血平可能会增强或减弱降血糖效果。(4) 本品可能会增强或减弱香豆素衍生物的作用。(5) 与含乙醇制剂同服时，可引起腹部绞痛、恶心、呕吐、头痛、面部潮红和低血糖。

格列吡嗪 Glipizide

(1) 合用下列药物可能导致低血糖发生：非甾体抗炎药、水杨酸、磺胺类、氯霉素、丙磺舒、双香豆素、单胺氧化酶抑制药、β 受体拮抗药、咪康唑（静脉、局部或阴道给药）。(2) 合用下列药物可能升高血糖水平：噻嗪利尿药、皮质类固醇、酚噻嗪、甲状腺制剂、雌激素、口服避孕药、苯妥英钠、烟酸、拟交感神经药、钙通道阻滞药和异烟肼。

格列喹酮 Gliquidone

(1) 合用下列药物可能导致低血糖发生：水杨酸类、磺胺类、抗结核药、四环素类、单胺氧化酶抑制药、β 受体拮抗药、氯霉素、双香豆素类和环磷酰胺。(2) 合用下列药物可能升高血糖水平：氯丙嗪、拟交感神经药、皮质激素类、甲状腺激素、口服避孕药和烟酸制剂。(3) 本品可减弱病人对乙醇的耐受力，而乙醇亦可能增强本品的降血糖作用。

格列美脲 Glimepiride

本品为 CYP2C9 代谢，合用酶抑制药或诱导药均会影响其作用。(1) 合用下列药物可能导致低血糖发生：胰岛素、口服降糖药、水杨酸、对氨水杨酸、皮质激素、雄激素、氯霉素、香豆素抗凝药、芬氟拉明、氯贝丁酯、ACE 抑制药、氟西汀、别嘌醇、抗交感神经药、环磷酰胺、异环磷酰胺、长效磺胺类、四环素族、单胺氧化酶抑制药、氟喹诺酮类、丙磺舒、咪康唑、己酮可可碱（胃肠外高剂量给药）、氟康唑等。(2) 合用下列药物可能升高血糖水平：雌激素和孕激素、噻嗪利尿药、促甲状腺激素、糖皮质激素、酚噻嗪及其衍生物、氯丙嗪、肾上腺素和其他拟交感神经药、烟酸（高剂量）及其衍生物、轻泻药（长期使用时）、苯妥英钠、高血糖素、巴比妥类、利福平、乙酰唑胺。

格列齐特 Gliclazide

(1) 避免乙醇和含有乙醇的药物，因可增加低血糖反应，同时具有低血糖昏迷发作的潜在风险。禁止与咪康唑合用，因可出现低血糖甚至昏迷。(2) 合用下列药物可能导致低血糖发生：胰岛素、阿卡波糖、双胍类降糖药、β 受体拮抗药、氟康唑、血管紧张素转换酶抑制药（如卡托普利、依那普利）、H_2 受体拮抗药、单胺氧化酶抑制药、磺胺类、非甾体抗炎药。(3) 合用下列药物可能升高血糖水平：达那唑、氯丙嗪、全身途径或局部途径的糖皮质激素、沙丁胺醇。

更昔洛韦 Ganciclovir

(1) 影响造血系统的药物、骨髓抑制药及放射治疗等与本品同用时，可增强对骨髓的抑制作用。(2) 与肾毒性药物同用时（如两性霉素 B、环孢素）可能增加肾损害。(3) 与齐多夫定同用时可增强对造血系统的毒性。(4) 与去羟肌苷同用或先后使用可使后者 AUC 显著增加，两者经肾清除量不变。(5) 与亚胺培南-西司他汀同用可发生全身抽搐。(6) 与丙磺舒或抑制肾小管分泌的药物合用可使本品的肾清除减少，易产生毒性反应。(7) 应避免与氨苯砜、喷他咪、氟胞嘧啶、长春新碱、长春碱、多柔比星、甲氧苄啶、磺胺类及核苷类药物合用。

谷氨酸钾 Potassium Glutamate

（1）在治疗肝性脑病时与精氨酸同时应用有加强作用，有利于血氨的降低，改善症状。（2）与抗胆碱药合用有可能减弱后者的药理作用。

贯叶连翘提取物

Hypericum Perforatum Extract

与地高辛、双香豆素、环孢素、茶碱等药物合用，可降低它们的血药浓度，使疗效降低。

鲑鱼降钙素 Etidronate Sodium

降钙素与锂合用可能导致血浆锂浓度下降，锂的剂量应予调整。

桂利嗪 Cinnarizine

（1）与乙醇、催眠药或镇静药合用，可加强镇静作用。（2）与苯妥英钠，卡马西平合用，可降低桂利嗪的血浆药物浓度。

果糖 Fructose

本品不宜与氨基已酸、氨苄西林素、呋塞米、肼苯哒嗪、硫喷妥钠、华法林等配伍。

过氧苯甲酰 Benzoyl Peroxide

与其他角质剥脱剂、药用肥皂等清洁剂及各种含乙醇的用品合用，可加重皮肤刺激或干燥。本品不宜与含乙醇的抗生素制剂同时使用。

蒿甲醚 Artemether

苯巴比妥可诱导本品代谢增快。

红霉素 Erythromycin

（1）红霉素升高阿芬太尼的血浆药物浓度。（2）当红霉素（胃肠外给药）与胺碘酮合用时增加室性心律失常的危险，应避免合用；克拉霉素、红霉素可能升高丙吡胺的血浆药物浓度，毒性增加。（3）红霉素（胃肠外给药）与莫西沙星合用时增加室性心律失常的危险，应避免合用；大环内酯类可能升高利福布汀的血浆药物浓度（增加葡萄膜炎的发生危险，合用时减少利福布汀的剂量）；利福霉素降低大环内酯的血药浓度。（4）大环内酯类可能增强香豆素类的抗凝作用。（5）抗抑郁药瑞波西汀避免其与大环内酯类抗生素合用。（6）大环内酯类抗生素可抑制卡马西平、丙戊酸钠、氯雷他定、咪唑斯汀的代谢，血药浓度增高。（7）抗疟药蒿甲醚／本芴醇避免与大环内酯类抗生素合用。（8）红霉素可能升高达非那新的血药浓度；托特罗定避免与克拉霉素和红霉素合用。（9）红霉素（胃肠外给药）与氨磺必利合用时，增加室性心律失常的危险，应避免合用；红霉素可能升高氯氮平的血药浓度（可能增加惊厥发生的危险）；克拉霉素与匹莫齐特合用，增加室性心律失常的危险，应避免合用；红霉素与匹莫齐特合用，可能增加室性心律失常的危险，应避免合用；大环内酯类抗生素可能升高喹硫平的血浆药物浓度（合用喹硫平需要减量）；大环内酯类抗生素与舍吲哚合用可能增加室性心律失常的危险，应避免合用；红霉素与舍吲哚合用增加室性心律失常的危险，应避免合用。（10）红霉素与安普那韦合用，两者血浆药物浓度均升高；克拉霉素与阿扎那韦合用，两者血浆药物浓度均升高；克拉霉素与依法韦仑合用，增加出现皮疹的危险；利托那韦升高克拉霉素的血浆药物浓度（肾功能不全者使用克拉霉素需要减量）；利托那韦可能升高阿奇霉素和红霉素的血浆药物浓度；替拉那韦升高克拉霉素的血浆药物浓度（肾功能不全的病人使用克拉霉素需要减量），同时克拉霉素能升高替拉那韦的血浆药物浓度；克拉霉素片剂抑制齐多夫定的吸收。（11）克拉霉素和红霉素抑制咪达唑仑的代谢（升高其血浆药物浓度且加强其镇静作用）；红霉素升高丁螺环酮的血浆药物浓度（合用时丁螺环酮需减量）；红霉素抑制佐匹克隆的代谢。（12）注射用红霉素与阿托西汀合用时，增加室性心律失常的发生危险。（13）红霉素可能抑制非洛地平的代谢（升高其血浆药物浓度）；乐卡地平避免其与红霉素合用；克拉霉素和红霉素可能抑制维拉帕米的代谢（增加毒性发生的危险）。（14）大环内酯类抗生素可升高地高辛的血浆药物浓度（增加毒性发生的危

险）。(15) 大环内酯类抗生素可能抑制环孢素的代谢（升高其血浆药物浓度）；克拉霉素和红霉素抑制环孢素的代谢（升高其血浆药物浓度）。(16) 红霉素升高西洛他唑的血浆药物浓度（同时红霉素的血浆药物浓度降低），应避免合用。(17) 红霉素可能抑制皮质激素的代谢；红霉素抑制甲泼尼龙的代谢；克拉霉素可能升高甲泼尼龙的血浆药物浓度。(18) 体外试验证实，红霉素和多西他赛可能有相互作用；红霉素增加长春碱的毒性，应避免合用。(19) 克拉霉素升高依普利酮的血浆药物浓度，应避免合用；红霉素升高依普利酮的血浆药物浓度（两者合用时依普利酮需减量）。(20) 红霉素可升高溴隐亭和卡麦角林的血浆药物浓度（增加毒性发生的危险）；大环内酯类可能升高溴隐亭和卡麦角林的血浆药物浓度（增加毒性发生的危险）。(21) 大环内酯类抗生素与麦角胺和二甲麦角新碱合用增加麦角中毒的危险，应避免合用。(22) 克拉霉素和红霉素升高依来曲普坦的血浆药物浓度（有毒性发生的危险），应避免合用。(23) 克拉霉素可能升高伊伐布雷定的血浆药物浓度，应避免合用；当红霉素和伊伐布雷定合用时，增加室性心律失常发生的危险，应避免合用。(24) 红霉素降低扎鲁司特的血浆药物浓度。(25) 克拉霉素升高阿托伐他汀的血浆药物浓度；红霉素与阿托伐他汀合用可能增加肌病发生的危险；红霉素降低瑞舒伐他汀的血浆药物浓度；克拉霉素或红霉素与辛伐他汀合用增加肌病发生的危险（避免合用）。(26) 大环内酯类抗生素可能使雌激素类药物的避孕作用减弱（危险性可能较小）。(27) 红霉素升高加兰他敏的血浆药物浓度。(28) 当红霉素（胃肠外给药）与羟乙磺酸喷他脒合用时增加室性心律失常发生的危险。(29) 红霉素可升高西地那非的血浆药物浓度，合用需减少西地那非的初始剂量。(30) 红霉素和西罗莫司合用，两者血浆药物浓度均升高。(31) 红霉素可抑制茶碱的代谢（升高其血浆药物浓度），如红霉素为口服给药，红霉素的血浆药物浓度也同时降低。(32) 西咪替丁升高红霉素的血浆药物浓度（增加毒性发生的危险，其中包括耳聋）。(33) 红霉素可升高伐地那非的血浆药物浓度（合用伐地那非需要减量）。

华法林 Warfarin

(1) 阿司匹林、水杨酸钠、胰高血糖素、奎尼丁、吲哚美辛、保泰松、奎宁、依他尼酸、甲苯磺丁脲、甲硝唑、别嘌醇、红霉素、氯霉素、某些氨基糖苷类抗生素、头孢菌素类、苯碘达隆、西咪替丁、氯贝丁酯、右甲状腺素、对乙酰氨基酚等：增强本品抗凝作用。(2) 苯妥英钠、巴比妥类、口服避孕药、雌激素、考来烯胺、利福平、维生素K类、氯噻酮、螺内酯、扑米酮、皮质激素等：降低本品抗凝作用。(3) 盐酸肾上腺素、阿米卡星、维生素 B_{12}、间羟胺、缩宫素、盐酸氯丙嗪、盐酸万古霉素等：不能与本品合用。(4) 水合氯醛：合用使水合氯醛药效和毒性均增强，应减量慎用。(5) 维生素K：维生素K吸收障碍或合成下降影响本品的抗凝作用。

附录

环孢素 Cyclosporin

(1) 与大环内酯类抗生素（红霉素、阿奇霉素、克拉霉素、交沙霉素）、多西环素、酮康唑、氟康唑、伊曲康唑、地尔硫䓬、尼卡地平、维拉帕米、胺碘酮、甲氧氯普胺、口服避孕药、雌激素、雄激素、别嘌醇、胆酸及其衍生物、蛋白酶抑制药、伊马替尼、氯喹、普罗帕酮合用，可增加本品的血浆药物浓度，应避免合用，必须合用时应监测本品浓度并调整剂量。(2) 本品可使甲氨蝶呤AUC显著增加。(3) 本品可使依维莫司、西罗莫司血浆药物浓度显著增加，而本品药动学只有轻微改变。(4) 本品可减少地高辛、秋水仙碱的清除，合用时，需密切的监测地高辛或秋水仙碱中毒的症状。(5) 本品可减少羟甲戊二酰辅酶A还原酶抑制药(洛伐他汀、辛伐他汀、阿托伐他汀、普伐他汀、氟伐他汀) 的清除，合用时可引起肌毒性（如肌痛、无力、肌炎和横纹肌溶解)，合用时，应降低HMG-CoA还原酶抑制药的剂量。(6) 本品可引起肾毒性（可导致实质性肾损害)，故与可导致肾功能损害的药物合用时需谨慎，用药期间应密切监测肾功能。本品显著提高双氯芬酸的生物利用

度，合用时应减少双氯芬酸剂量。(7) 与糖皮质激素、硫唑嘌呤、苯丁酸氮芥、环磷酰胺等免疫抑制药合用时，可能会增加感染和患淋巴细胞增生性疾病的危险，故应谨慎。近3个月内接受环磷酰胺治疗的患者禁用本品。(8) 与硝苯地平合用，可使牙龈增生的发生率增加，故应避免合用。(9) 与保钾药（如留钾利尿药、血管紧张素转换酶抑制药、血管紧张素Ⅱ受体拮抗药）和含钾的药物合用，可致血钾升高。(10) 使用本品的同时，输入贮存超过10日的库存血可致血钾升高。(11) 与抗结核药合用，可降低本品的有效浓度，应根据血浆药物浓度调整剂量。(12) 安乃近、巴比妥盐、卡马西平、苯妥英钠、萘夫西林、磺胺二甲嘧啶静脉注射药、利福平、奥曲肽、普罗布考、奥利司他、圣约翰草、噻氯匹定、磺吡酮、特比萘芬可使本品血浆药物浓度降低。(13) 肝酶诱导剂可诱导肝微粒体的酶系统而增加本品的代谢，故两药合用时须调整本品的剂量。(14) 本品可能降低疫苗接种的效果，故使用本品期间应避免使用减毒活疫苗。(15) 银屑病患者不应与β受体拮抗药或利尿药合用。

环磷酰胺 Cyclophosphamide

(1) 环磷酰胺可使血清中假胆碱酯酶减少，血清尿酸水平增高，与抗痛风药如别嘌醇、秋水仙碱、丙磺舒等同用时，应调整剂量。(2) 本品可加强氯琥珀胆碱的神经肌肉阻滞作用，使呼吸暂停延长。(3) 环磷酰胺可抑制胆碱酯酶活性，因而延长可卡因的作用并增加毒性。(4) 大剂量巴比妥类、皮质激素类药物可影响本品代谢，同时应用可增加环磷酰胺的急性毒性。

环轮宁 Cycleanine Dimethobromide

(1) 环轮宁与氯化戊烯双季胺有协同作用。(2) 新斯的明可加速本品呼吸抑制的恢复。

黄酮哌酯 Tolterodine

(1) 抗胆碱药、三环类抗抑郁药、抗组胺药使本品作用增强。(2) 钾盐：可能加重溃疡病。(3) 维生素C：可能降低疗效。

磺胺甲噁唑 Sulfamethoxazole

(1) 同时应用碱化尿液药可增强磺胺药在碱性尿中的溶解度，使排泄量增多。(2) 骨髓抑制药与磺胺药同用可能增强潜在的不良反应。(3) 口服含雌激素的避孕药者同时长时间应用磺胺药可致避孕的可靠性减少，并增加经期外出血的机会。(4) 溶栓药与磺胺药同用时，可能增大其潜在的毒性作用。(5) 接受磺胺药治疗者对维生素K的需要量增加。(6) 乌洛托品在酸性尿中可分解产生甲醛，后者可与磺胺形成不溶性沉淀物，增加结晶尿。(7) 当治疗细菌性脑膜炎或其他严重感染需要应用具快速杀菌作用的药物（青霉素类）时，抑菌药（磺胺药）的同时应用有可能干扰青霉素类的杀菌作用，故两类药物最好避免同时应用。(8) 下列药与磺胺药同用时，后者可取代这些药物的蛋白结合部位，或抑制其代谢，以致药物作用时间延长或发生毒性，因此在应用磺胺药之后使用时需调整剂量；此类药物包括口服抗凝药、口服降血糖药、甲氨蝶呤、苯妥英钠和硫喷妥钠。具肝毒性药与磺胺药应用，可能增高肝毒性。

磺胺嘧啶 Sulfadiazine

(1) 与甲氧苄啶合用可产生协同作用。(2) 与口服抗凝药、口服降糖药、甲氨蝶呤、苯妥英钠和硫喷妥钠同用时，可增强药物作用、时间延长或毒性增加。(3) 与骨髓抑制药合用可能增强此类药物对造血系统的不良反应。(4) 与溶栓药合用可能增大其潜在的毒性作用。(5) 与肝毒性药物合用可能增高肝毒性。(6) 与酸性药物如维生素C合用，可析出结晶。(7) 本品有可能干扰青霉素类药物的杀菌作用。(8) 合用尿碱化药可增加本品在碱性尿中的溶解度，使排泄增多。(9) 与环孢素同用可降低环孢素的作用。

吉非贝齐 Gemfibrozil

（见非诺贝特）

吉非替尼 Gefitinib

(1) 与CYP3A4抑制药同用，可抑制本品代谢，血浆浓度升高。(2) 与CYP3A4诱导剂合用，可增加代谢并血浆浓度降低。(3) 抗酸药能使本品AUC降低。(4) 与经CYP2D6代谢的底物美托洛尔合用可使后者血浆药物浓度升高。(5) 与华法林合用可出现INR升高和（或）出血事件。(6) 与长春瑞滨同用可能加剧后者的减少中性白细胞作用。

吉西他滨 Gemcitabine

联合或序贯化疗时，应考虑骨髓抑制作用的加剧。

己酮可可碱 Pentoxifylline

(1) 与抗血小板或抗凝血药合用时，凝血时间延长。在应用华法林的患者中合用此药时应当减少剂量。(2) 与茶碱类药物合用时有协同作用，将增加茶碱的药效与毒性反应。因此必须调整茶碱和己酮可可碱的剂量。(3) 与抗高血压药、β受体拮抗药、毛地黄、利尿药、抗糖尿病及抗心律失常药物合用时没有明显的交叉反应发生，但可有轻度加重血压下降，应当注意。

己烯雌酚 Diethylstilbestrol

(1) 抗凝药：雌激素可降低抗凝药的效应，必须同用时，应调整抗凝药用量。(2) 卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮、利福平等可增加雌激素的代谢，减低雌激素的效应。(3) 三环类抗抑郁药：大量雌激素可增强抗抑郁药的不良反应，同时降低其应有的效应。(4) 本品可减低抗高血压药的作用。(5) 他莫昔芬可降低本品治疗效果。(6) 钙剂可增加本品吸收。

甲氨蝶呤 Methotrexate

(1) 本品与乙醇和其他有肝损害的药物同用可增加肝毒性。(2) 可引起血尿酸水平增高。(3) 可增加抗凝药的作用，与其他抗凝药同用宜谨慎。(4) 与磺胺药同用可能会引起本品血药浓度增高。(5) 口服新霉素可减少其吸收。(6) 与有机酸和水杨酸盐同用，可抑制本品肾排泄而导致血药浓度增高。(7) 与氨苯蝶啶、乙胺嘧啶等同用不良反应增加。(8) 与氟尿嘧啶同用，或先用氟尿嘧啶后用本品，可产生拮抗作用，但如先用本品，4～6小时后再用氟尿嘧啶则可产生协同作用。(9) 与门冬酰胺酶合用可减效，如后者用药10日使用本品或于本品用药后24小时内给予门冬酰胺酶，则可增效。(10) 与其他骨髓抑制药同用宜谨慎。

甲苯咪唑 Mebendazole

(1) 西咪替丁可减慢本品的代谢，增加其血药浓度。(2) 卡马西平、苯妥英钠或磷苯妥英钠可加速本品代谢，减低其疗效。

甲氟喹 Mefloquine

(1)与胺碘酮合用增加室性心律失常。(2) 甲氟喹可拮抗卡马西平和丙戊酸盐的抗惊厥作用。(3) 蒿甲醚／本芴醇避免与甲氟喹合用；因可增加发生惊厥的危险。与奎宁、匹莫齐特、阿托西汀合用时增加室性心律失常的发生。(4) 与β受体拮抗药、钙通道阻滞药、地高辛合用时可能增加心动过缓的危险。

甲睾酮 Methyltestosterone

(1) 巴比妥类药可增加其代谢，使作用减弱。(2) 本品与甲状腺激素竞争，减少甲状腺素结合球蛋白，使作用增强。(3) 糖皮质激素增加本品水肿危险。(4) 与抗凝药合用，抗凝活性增加，需减少用量。

甲磺酸双氢麦角碱 Dihydroergotmine Mesylate

(1) 与环孢霉素合用，将改变环孢素的药动学。(2) 多巴胺与双氢麦角毒碱联合应用时，可诱导周围血管痉挛，特别是肢体远端血管收缩。

甲磺酸溴隐亭 Bromocriptine Mesylate

(1) 与左旋多巴合用有协同作用。(2) 与红霉素、奥曲肽合用，可使本品血浆药物浓度升高，毒性增强，应谨慎。(3) 忌与抗高血压药合用，以避免低血压。(4) 氟哌啶醇、甲基多巴、甲氧氯普胺、

附录

单胺氧化酶抑制药、吩噻嗪类、H_2受体拮抗药、利血平等均可升高血清催乳素浓度，干扰本品的作用，必须合用时需调整本品剂量。(5) 与乙醇合用可出现双硫仑样反应。

甲基多巴 Methyldopa

(1) 本品可增加口服抗凝药的作用。(2) 本品可加强中枢神经抑制药的作用。(3) 三环类抗抑郁药、拟交感胺类药、非甾体抗炎药：可减弱本品的降压作用。(4) 本品可干扰溴隐亭的作用。(5) 本品与其他抗高血压药合用有协同作用。(6) 左旋多巴：合用可加强中枢神经毒性作用。(7) 麻醉药：合用须减少麻醉药的剂量。(8) 锂盐：合用时须防备锂盐的毒性作用。

甲萘醌亚硫酸钠 Menadion Sodium Bisulfite

(1) 与双香豆素类口服抗凝药合用，可干扰维生素K的代谢，并使作用相互抵消。(2) 与较大剂量的水杨酸类、磺胺药、奎宁、奎尼丁等合用，可影响本品的疗效。

甲哌卡因 Mepivacaine

(1) 如果同用镇静药，应减少麻醉药的剂量。(2) 应避免与以下药物合用：血管紧张药、β受体拮抗药、抗心律失常药、麦角类催产药等。

甲泼尼龙 Methylprednisolone

(1)糖皮质激素与噻嗪类利尿药合用，会增加糖耐量异常的危险。(2) 糖皮质激素会增加糖尿病患者对胰岛素和口服降糖药的需求。(3) 服用糖皮质激素的患者不可接种牛痘，也不可接受其他免疫措施，特别是大剂量服用的患者，因为有出现神经系统并发症和（或）缺乏抗体反应的危险。(4) 糖皮质激素与阿司匹林联合用于凝血酶原过少的患者时应谨慎。(5) 与大剂量甲泼尼龙服用，可使环孢素引起惊厥。(6) 与水杨酸类药合用，可增加发生消化道并发症的危险。

甲羟孕酮 Medroxyprogesterone

(1) 本品可显著降低氨鲁米特的生物利用度。(2) 与糖皮质激素合用可促进血栓性疾病的发生。

甲巯咪唑 Thiamazole

(1) 与抗凝药合用，可增强抗凝作用。(2) 高碘食物或药物的摄入可使甲状腺功能亢进病情加重，使抗甲状腺药需要量增加或用药时间延长。故在服用本品前避免服用碘剂。(3) 磺胺类、对氨水杨酸、巴比妥类、酚妥拉明、妥拉唑林、维生素B_{12}、磺酰脲类等都有抑制甲状腺功能和甲状腺肿大的作用，故合用本品须注意。

甲硝唑 Metronidazole

(1) 本品能增强华法林等抗凝药的作用。(2) 与苯妥英钠、苯巴比妥等合用时，可加强本品代谢。(3) 与西咪替丁等酶抑制药合用时，可减慢本品的代谢及其排泄。(4) 土霉素可干扰本品清除阴道毛滴虫的作用。(5) 与糖皮质激素同用时需加大本品用量。(6) 薄荷脑促进本品经皮肤渗透吸收。

甲氧苄啶 Tvimethoprim

(1) 与胺碘酮合用增加室性心律失常的发生；使普鲁卡因胺的血浆药物浓度升高。(2) 利福霉素可能使本品的血药浓度降低；与氨苯砜合用两者的血药浓度均升高。(3) 可能增强香豆素类的抗凝作用。(4) 可能使瑞格列奈的降血糖作用增强。(5) 可使苯妥英钠的血药浓度升高，同时叶酸拮抗作用增强。(6) 与乙胺嘧啶合用叶酸拮抗作用增强。(7) 可使拉米夫定的血药浓度升高，避免拉米夫定与大剂量复方磺胺甲噁唑合用。(8) 可能使地高辛的血药浓度升高。(9) 与环孢素合用增加肾毒性的发生，静脉给予使环孢素的血药浓度降低。(10) 与硫唑嘌呤、巯嘌呤及甲氨蝶呤合用增加血液学毒性的发生。(11) 与依普利酮合用增加高钾血症的发生。

甲氧氯普胺 Metoclopramide

（1）可影响某些药物的药动学，如抗菌药物类。（2）与硫酸镁有协同性利胆作用。（3）胆碱药可影响本品的药理作用。（4）与中枢抑制药合用时两者的镇静作用均增强。（5）苯海索、苯海拉明可治疗本品所致的锥体外系运动亢进。（6）可减轻甲硝唑的胃肠道不良反应。（7）与吩噻嗪类合用时锥体外系反应的发生率与严重性均可有所增加。（8）本品有增加抗高血压药的直立性低血压及低血压危险。（9）有耳毒性药禁与本品联用。（10）本品可加快乙醇在小肠内的吸收。

甲氧沙林 Methoxsalen

二甲基亚砜可增加本品的渗透性。治疗期间不得服用其他光敏性药物。本品与吩噻嗪类药物同用可加剧对眼脉络膜、视网膜和晶状体的光化学损伤。

间羟胺 Metaraminol

（1）环丙烷、氟烷或其他卤化羟类麻醉药、洋地黄或其他拟肾上腺素药：合用易致心律失常。（2）单胺氧化酶抑制药：使本品升压作用增强。

碱式碳酸铋（次碳酸铋）Bismuth Subcarbonate（Bismuth Oxycarbonate）

（1）不宜与乳酶生同时应用。（2）应避免同时服用四环素、土霉素、环丙沙星、诺氟沙星等口服抗菌药物。（3）本品可使口服地高辛吸收减少。

交沙霉素 Josamycin

与含有麦角胺制剂合用，有可能引起四肢缺血，应考虑将其用量减小并应慎重给药。

胶体果胶铋 Colloidal Bismuth Pectin

不宜与抗酸药物同时服用，否则会降低药效。

结合雌激素 Conjugated Estrogen

与利福平合用时，应增加本品剂量。

金刚烷胺 Amantadine

（1）与乙醇合用，中枢抑制作用增强。（2）与其他抗帕金森病药、抗胆碱药、抗组胺药、吩噻嗪类或三环类抗抑郁药合用，抗胆碱反应增强。（3）与中枢兴奋药合用，可加强中枢兴奋作用，甚至引起惊厥或心律失常。（4）和多潘立酮、甲氧氯普胺、丁苯那嗪合用增加锥体外系不良反应。（5）和美金刚合用增加中枢神经系统毒性。

精蛋白锌胰岛素 Protamine Zinc Insulin

（1）糖皮质激素、促肾上腺皮质激素、胰高血糖素、雌激素、口服避孕药、甲状腺素、肾上腺素、噻嗪类利尿药、二氮嗪、β_2受体激动药、H_2受体拮抗药、钙通道阻滞药、可乐定、苯妥英钠等可升高血糖浓度，合用时应调整这些药或胰岛素的剂量。（2）口服降糖药与胰岛素有协同降血糖作用。（3）抗凝药、水杨酸盐、磺胺类药及抗肿瘤药甲氨蝶呤等可与胰岛素竞争和血浆蛋白结合，从而使血液中游离胰岛素水平增高。非甾体抗炎药可增强胰岛素降血糖作用。（4）β受体拮抗药如普萘洛尔可阻止肾上腺素升高血糖的反应，干扰机体调节血糖功能，与胰岛素合用可增加低血糖的危险，并可掩盖某些低血糖症状，延长低血糖时间。合用时应注意调整胰岛素剂量。（5）氯喹、奎尼丁、奎宁等可延缓胰岛素的降解，使血中胰岛素浓度升高从而加强其降血糖作用。（6）血管紧张素转换酶抑制药、溴隐亭、氯贝丁酯、酮康唑、锂盐、甲苯咪唑、维生素B_6、茶碱等可通过不同方式直接或间接影响致血糖降低，胰岛素同上述药物合用时应适当减量。（7）奥曲肽可抑制生长激素、胰高糖素及胰岛素的分泌，并使胃排空延迟及胃肠道蠕动减缓，引起食物吸收延迟，从而降低餐后高血糖，在开始用奥曲肽时，胰岛素应适当减量，以后再根据血糖调整。

肼屈嗪 Hydralazine

（1）非甾体抗炎药：同用可使降压作用减弱。（2）拟交感胺类：与本品同用可使本品的降压作用降低。（3）二氮嗪或其他抗高血压药：同用可使降压作用加强。

枸橼酸铋钾

Bismuth Potassium Citrate

（1）不宜同时服用抗酸药。（2）影响大环内酯类抗生素的吸收。

枸橼酸铋雷尼替丁

Ranitidine Bismuth Citrate

与牛奶同时进服，会干扰枸橼酸铋的作用。（其他见法莫替丁）

聚乙二醇4000 Macrogol 4000

与其他药物同时服用时可能会阻碍其他药物的吸收，建议最好与其他药物间隔2小时口服。

聚乙二醇电解质散

Polyethylene Glycol Electrolyte Powder

与其他药物同时服用时可能会阻碍其他药物的吸收，建议最好与其他药物间隔2小时口服。

卷曲霉素 Capreomycin

（1）与氨基苷类抗生素合用可增加产生耳、肾毒性和神经肌肉阻滞作用，可能导致呼吸抑制或麻痹（呼吸暂停），与多黏菌素E或多黏菌素合用可增加肾毒性。（2）另与有耳、肾毒性的药物合用时，可增加耳毒性、发生耳鸣、耳聋、听力减退。（3）与噻嗪类、曲美苄胺合用时，可掩盖本品所致的耳鸣、耳聋、头晕或眩晕等耳毒性症状。（4）与阿片类药合用时可能增加中枢呼吸抑制，导致呼吸抑制或呼吸麻痹。（5）卷曲霉素与铂类化合物合用时增加肾毒性及耳毒性。（6）与乙硫异烟肼合用，可增加本品的不良反应。

卡巴克络 Carbazochrome

（1）本品可降低氟哌啶醇等抗精神病药的效应，两者合用可使精神病病情恶化。（2）与阿托品合用可降低本品的止血效果。（3）大剂量给药可降低抗癫痫药的效果。（4）与苯海拉明合用可降低疗效。

卡贝缩宫素 Carbetocin

卡贝缩宫素的结构与缩宫素非常相近，因此，类似药物的某些相互作用有可能发生。

卡比多巴 Carbidopa and Levodopa

（1）与抗高血压药合用可出现直立性低血压。（2）与抗抑郁药合用可致高血压和运动障碍。（3）铁剂可降低本品的生物利用度。

卡比马唑 Carbimazole

（1）与抗凝血药合用，可增强抗凝作用。（2）高碘食物或药物的摄入，可使甲状腺功能亢进的病情加重，使抗甲状腺药需要增加剂量或用药时间延长。故在服用本品前避免服用碘剂。（3）磺胺类、对氨基水杨酸、保泰松、巴比妥类、酚妥拉明、妥拉唑林、维生素B_{12}、磺酰脲类降糖药等都有抑制甲状腺功能和甲状腺肿大的作用，与本品合用须应注意。

卡泊芬净 Caspofungin

（1）利福平能使卡泊芬净的血药浓度先升高后降低，适当调整剂量。（2）卡马西平、苯妥英钠可降低卡泊芬净的血药浓度。（3）抗病毒药依法韦恩和奈韦拉平可能降低卡泊芬净的血药浓度。（4）环孢素能增高卡泊芬净的血药浓度。（5）地塞米松可能降低卡泊芬净的血药浓度。（6）卡泊芬净能降低他克莫司的血药浓度。

卡铂 Carboplatin

尽量避免与可能损害肾功能的药物如氨基糖苷类抗生素同时使用。与其他抗癌药联合应用时，应注意适当降低剂量。

卡马西平 Carbamazepine

（1）三环类抗抑郁药、马普替林、噻吨类、红霉素、异烟肼、维拉帕米、地尔硫䓬、氟西汀、西咪替丁、乙酰唑胺、达那唑、地昔帕明等药可提高本品的血浆药

物浓度，引起毒性反应。(2) 本品与氯贝丁酯、去氨加压素、赖氨加压素、垂体后叶素等合用时，可加强抗利尿作用，合用各药均需减量。(3) 与对乙酰氨基酚合用，尤其是单次超量或长期大量使用时，可增加肝脏中毒的危险，并使对乙酰氨基酚的疗效降低。(4) 与腺苷合用，发生心脏传导阻滞危险增加。(5) 与碳酸酐酶抑制药合用时，可增加骨质疏松的危险性。(6) 与锂盐、甲氧氯普胺或精神安定药，如氟哌啶醇、硫利达嗪合用，能增加中枢神经系统不良反应。此外，锂盐还可以降低本品的抗利尿作用。(7) 与环孢素、洋地黄类（地高辛除外）、乙琥胺、茶碱、扑米酮、苯二氮䓬类、丙戊酸钠、多西环素、糖皮质激素、左甲状腺素或奎尼丁等合用时，可使后者药效降低，需注意调整剂量。

卡莫氟　Carmofur

与其他细胞毒药物联用应酌情减量。

卡莫司汀　Carmustine

联合化疗时，应避免合用有严重降低白细胞、血小板或产生严重胃肠反应的抗癌药；与西咪替丁合用可加重骨髓抑制。

卡培他滨　Capecitabine

(1) 含氢氧化铝和氢氧化镁的抗酸药可使本品的血浆浓度轻微增加。(2) 亚叶酸钙能增加氟尿嘧啶浓度，毒性增加。

卡托普利　Captopril

(1) 利尿药：合用时降压作用增强。(2) 保钾利尿药：合用时，增加高钾血症的风险。(3) 非甾体抗炎药：尤其是与吲哚美辛合用，通过抑制肾前列腺素合成而减弱降压作用。(4) 其他扩血管药：合用时可致低血压，应从小剂量开始。(5) 其他抗高血压药：降压作用加强。其中与引起肾素释出或激活交感活性的药物呈较大的相加作用，与肾上腺素 β 受体拮抗药合用相加作用不显著。(6) 本品可减少锂的排泄，可能引起锂中毒。

卡维地洛　Carvedilol

(1) 地尔硫䓬：心脏传导障碍。(2) 地高辛：在使用卡维地洛的开始阶段，剂量调整阶段及停用卡维地洛时均应加强地高辛血浆药物浓度的监测。(3) 胰岛素或口服降糖药：增强胰岛素或口服降糖药的作用，而低血糖的症状和体征（尤其是心动过速）可能被掩盖或减弱。(4) 利福平：降低卡维地洛的血浆药物浓度。(5) 西咪替丁：增高卡维地洛的血浆药物浓度。(6) 麻醉药：出现负性肌力作用及低血压等。(7) 强心苷：延长房室传导时间。

坎地沙坦　Candesartan

(1) 保钾利尿药、补钾药：合用时可出现血清钾浓度升高，特别对肾功能障碍的患者。(2) 利尿药：接受利尿抗高血压药治疗的患者初次服用本品时，可能增强降压作用，故应从小剂量开始。

抗真菌药（咪唑类）

(1)酮康唑可抑制丁丙诺啡的代谢(降低丁丙诺啡的剂量)；抗酸药减少酮康唑的吸收。(2) 酮康唑和丙吡胺合用增加室性心律失常的危险。(3) 利福平加速酮康唑的代谢，酮康唑也会降低利福平的血药浓度；异烟肼可降低酮康唑的血药浓度。(4) 咪康唑增强香豆素的抗凝作用（咪康唑口服凝胶和可能吸收的阴道制剂）；酮康唑增强香豆素的抗凝作用。(5) 瑞波西汀避免和咪唑类抗真菌药合用；酮康唑升高米氮平的血药浓度。(6) 咪康唑可增强格列齐特和格列吡嗪的降糖作用；咪康唑升高磺酰脲类的血药浓度。(7) 酮康唑和咪康唑可能升高卡马西平的血浆药物浓度；苯妥英钠可能降低酮康唑的血药浓度；咪康唑增强苯妥英钠的抗惊厥作用（苯妥英钠的血浆药物浓度升高）。(8) 唑类抗真菌药可能拮抗两性霉素 B 的作用。(9) 酮康唑可升高氯雷他定的血药浓度；唑类抗真菌药可抑制咪唑斯汀的代谢。(10) 抗疟药蒿甲醚／本芴醇避免与咪唑类抗真菌药合用。(11) 抗胆碱药减少酮康唑的吸收；酮康唑升高达非那新的血药浓度；酮康唑增加索非那新的血药浓度；托特罗定避免和酮康唑合用。(12) 酮康唑抑制阿立哌唑的代谢；咪唑类和匹莫齐特合用增加心律失常的危险；咪唑类可

能升高喹硫平的血药浓度；唑类抗真菌药和舍吲哚合用增加室性心律失常的危险。(13) 安普那韦升高酮康唑的血药浓度；酮康唑抑制茚地那韦的代谢；奈韦拉平降低酮康唑的血药浓度；酮康唑和利托那韦合用可能升高某一种药的血药浓度（或者两者都升高)。(14) 咪唑类可能升高沙奎那韦、阿普唑仑、咪达唑仑、阿瑞吡坦、波生坦、非洛地平、乐卡地平、尼索地平、环孢素、西洛他唑、糖皮质激素、厄洛替尼、舒尼替尼、紫杉醇、依普利酮、多潘立酮等的血药浓度。(15) 咪唑类抗真菌药和麦角或麦角制剂合用增加麦角中毒的危险。(16) 酮康唑升高阿莫曲坦、伊来曲普坦、他汀类、加兰他敏、他达那非、西地那非、伐地那非、西罗莫司、他克莫司、茶碱等血药浓度。(17) 偶有咪唑类与雌激素合用可能导致避孕失败。(18) H_2 受体拮抗药、质子泵抑制药和硫糖铝减少酮康唑的吸收。

附录

可待因 Codeine

与中枢抑制药合用有相加作用。

可的松 Cortisone

(1) 使用本品时，不能同时使用其他糖皮质激素，如丙酸倍氯米松、布地奈德等。(2) 胰岛素与本品有拮抗作用，糖尿病患者应注意调整本品的剂量。(3) 本品可能影响甲状腺对碘的摄取、清除和转化。(4) 应避免与酮康唑合用。

可乐定 Clonidine

(1) 乙醇、巴比妥类、镇静药：可加强中枢抑制作用。(2) 其他抗高血压药：可加强降压作用。(3) β 肾上腺素受体拮抗药：合用后停用本品，发生撤药综合征危象的可能增加，宜先停用 β 肾上腺素受体拮抗药，再停本品。(4) 三环类抗抑郁药：减弱本品的降压作用。(5) 非甾体抗炎药：减弱可本品的降压作用。

克拉霉素 Clarithromycin

(1) 与利福平或利福布汀合用时，本品血浆药物浓度明显下降。(2) 与特非那定合用时，可引起后者血浆药物浓度过高，产生心脏毒性。(3) 克拉霉素能增强瑞格列奈的作用。(4) 克拉霉素可能升高阿瑞吡坦、伊曲康唑的血浆药物浓度。(5) 克拉霉素或红霉素可增加秋水仙碱的毒性发生危险。用克拉霉素和红霉素可能升高西地那非、他达那非的血药浓度。(6) 克拉霉素与奥美拉唑合用，两者血浆药物浓度均升高。

克林霉素 Clidamycin

(1) 克林霉素能够增强非去极化型肌松药和氯琥珀胆碱的作用。(2) 克林霉素能拮抗新斯的明和吡斯的明的作用。(3) 本品与红霉素有拮抗作用，不宜联合应用。

克仑特罗 Clenbuterol Hydrochloride

与单胺氧化酶抑制药合用，可使心动过速、激动或轻躁狂等的发生率增加。

枯草杆菌、肠球菌二联活菌制剂 Live Combined B Subtilis and E. Faecium

(1) 本品与抗菌药同服可减弱其疗效，应分开服用。(2) 铋剂、鞣酸、药用炭、酊剂等能抑制、吸附活菌，不能并用。(3) 如正在服用其他药品，服用本品前请咨询医师或药师。

奎尼丁 Quinidine

(1) 与其他抗心律失常药合用时可致作用相加。(2) 口服抗凝药：合用可使凝血酶原进一步减少，也可减少本品与蛋白的结合。故需注意调整合用时及停药后的剂量。(3) 地高辛：可使地高辛血清浓度增高以致达中毒水平，故应监测血药浓度及调整剂量。在洋地黄过量时本品可加重心律失常。(4) 抗高血压药、扩血管药及 β 拮抗药：合用时本品可加剧降压及扩血管作用；与 β 拮抗药合用时还可加重对窦房结及房室结的抑制作用。(5) 利福平：增加本品的代谢，使血浆药物浓度降低。(6) 异丙肾上腺素：可能加重本品过量所致的心律失常，但对 QT 间期延长导致的扭转性室性心动过速有利。

奎宁 Quinine

(1) 抗酸药及铝剂能延缓或减少奎

宁的吸收。(2) 与抗凝药合用，抗凝作用可增强。(3) 与氯琥珀胆碱、筒箭毒碱等、奎宁合用，可引起呼吸抑制。(4) 与奎尼丁合用，金鸡纳反应可增加。(5) 与碳酸氢钠等合用，可增加肾小管对奎宁的重吸收，导致奎宁血药浓度与毒性增加。(6) 与维生素 K 合用可增加奎宁的吸收。(7) 与布克利嗪、赛克力嗪、美克利嗪、吩噻嗪类、噻吨类、曲美苄胺合用可导致耳鸣、眩晕。(8) 与硝苯地平合用，游离的奎宁浓度增加。

喹硫平　Quetiapine

(1) 与乙醇或其他中枢神经抑制药合用，可加重中枢抑制作用。(2) 与卡马西平、苯妥英钠、硫利达嗪合用时会增加本品的清除率。(3) 丙米嗪或氟西汀不改变本品药动学，但与抗真菌药或大环内酯类抗生素合用需慎重。(4) 可拮抗多巴胺受体激动药的作用。(5) 可能增加某些抗高血压药的降压作用。

拉贝洛尔　Labetalol

(1) 三环类抗抑郁药可增加震颤的发生率。(2) 西咪替丁可增加本品的生物利用度。

拉米夫定　Lamivudine

(1) 甲氧苄啶（复方磺胺甲噁唑）能升高其血药浓度，应避免与大剂量的复方磺胺甲噁唑合用。(2) 恩曲他滨避免与拉米夫定合用，拉米夫定避免与膦甲酸钠或更昔洛韦注射剂合用。

拉莫三嗪　Lamotrigine

(1) 舍曲林可抑制本品的代谢，使之毒性增强，引起疲乏、镇静、意识混乱等。(2) 服用丙戊酸钠的患者加服本品后，丙戊酸钠血药浓度降低；反之，丙戊酸钠可使拉莫三嗪血药浓度增加约 40%。(3) 本品使苯妥英钠和卡马西平的稳态血药浓度分别降低 45% ~ 54% 和 40%。(4) 奥卡西平可增加本品的代谢，减少其血浆药物浓度，使其抗癫痫作用减弱。(5) 对乙酰氨基酚可加速本品的排泄。

拉西地平　Lacidipine

(1) 与其他抗高血压药：降压作用可能增强。(2) 西咪替丁：抑制本品代谢，降压作用增强。(3) 葡萄柚汁：抑制本品代谢，可能使降压作用增强。(4) 地高辛：本品可能使地高辛血浆药物浓度升高。

拉氧头孢　Latamoxef

(1) 与其他头孢菌素在体外试验中，可诱导革兰阴性菌产生 β 内酰胺酶而耐药，不宜与后者合用；与氨基苷类抗生素合用，应监测肾功能。(2) 与呋塞米（速尿）等强效利尿药合用可增加肾损害。(3) 不宜与抗凝药合用，以免引起出血。(4) 用药期间不得饮酒。

赖氨匹林　Lysine Acetylsalicylate

(1) 与其他非甾体抗炎药合用时，使胃肠道不良反应增加，而疗效并不加强。(2) 与抗酸药（长期大量应用）或尿碱化药合用，碱性尿可增加本品排泄，使血浆药物浓度降低。当血浆药物浓度已达稳定状态停用碱性药可使血浆药物浓度升高到毒性水平，应予注意。(3) 与口服抗凝血药合用时，可能增加出血的危险。(4) 碳酸酐酶抑制药可使尿碱化，甚至可引起代谢性酸中毒，不仅能导致水杨酸盐排泄增加，血浆药物浓度降低，而且透入脑组织中的量也增加，出现毒性反应。(5) 糖皮质激素可增加水杨酸盐的排泄，合用时，为维持本品的血浆药物浓度，必要时应增加本品的剂量。但可增加发生消化道溃疡的危险。(6) 与胰岛素或口服降糖药合用，可加强降低糖药的的药效。(7) 与甲氨蝶呤合用时，可减少甲氨蝶呤与蛋白的结合，减少其从肾脏的排泄，使血浓度升高而毒性反应增加。(8) 丙磺舒或硫氧唑酮的排尿酸作用，可因同时应用本品而降低；当水杨酸盐的血浆药物浓度 >50 μg/ml 时降低即明显，超过 100 ~ 150 μg/ml 时更甚。此外，丙磺舒可降低水杨酸盐自肾脏的清除率，从而使后者的血浆药物浓度升高。(9) 尿酸化药：酸性尿可减低水杨酸盐的排泄，使后者血浆药物浓度升高。水杨酸血浓度已达稳定状态的患者加用尿酸

化药后可能导致水杨酸盐血浓度升高，毒性反应增加。

来氟米特 Leflunamide

（1）来氟米特和其他肝毒性药物合用可能增加不良反应。（2）单剂量来氟米特和多剂量利福平联合使用，使本品血浆峰浓度较单独使用来氟米特升高（20% ~ 40%），因此当两药合用时应慎重。

来曲唑 Letrozol

（1）经 CYP3A4 代谢的药物可能会影响对本品的代谢。（2）与经 CYP2C19 酶代谢的药物谨慎合用。（3）与他莫昔芬（一日 20 mg）合用，本品血浆浓度下降 30%。

兰索拉唑 Lansoprazole

（1）影响非甾体解热镇痛药、茶碱类、抗真菌药、大环内酯类抗生素等药物的代谢。（2）抗酸药、黏膜保护药使本品的生物利用度减小。

榄香烯 Elemene

与放疗或其他化疗药及生物反应调节药联合应用有协同作用。

乐卡地平 Lercanidipine

（1）其他抗高血压药：降压作用可能增强。（2）西咪替丁：抑制本品代谢，降压作用增强。（3）葡萄柚汁：抑制本品代谢，降压作用增强。（4）抗惊厥药（苯妥英钠、卡马西平）促进本品代谢，降压作用减弱。（5）利福平：促进本品代谢，降压作用减弱。

雷贝拉唑钠 Rabeprazole Sodium

（1）轻度增加苯巴比妥类药物血药浓度。（2）抗酸药影响本品的吸收。

雷公藤总苷 Tripterygium Glycosides

本品与糖皮质激素合用可增强疗效，合用时应减少激素用量，从而可减少本品致白细胞降低等不良反应。

雷奈酸锶 Strontium Ranelate

（1）与牛奶和牛奶制品及钙制剂合用可降低雷奈酸锶生物利用度达 60% ~ 70%。因此，服用本品和上述食品或药品时应当至少间隔 2 小时。（2）抗酸药氢氧化铝和氢氧化镁在服用雷奈酸锶之前 2 小时服用或同时服用，使雷奈酸锶的吸收稍有降低（药时曲线下面积降低 20% ~ 25%），但是当在服用雷奈酸锶之后 2 小时服用抗酸剂，吸收几乎未受影响，因此最好在服用雷奈酸锶 2 小时后再服用抗酸药。（3）由于二价金属离子能与口服的四环素和氟喹诺酮类药在胃肠道形成复合物，从而减少后者的吸收，因此，不推荐雷奈酸锶与上述药品同时服用。在服用四环素或氟喹诺酮时，应暂时停用雷奈酸锶。

利巴韦林 Ribavirin

本品可抑制齐多夫定转变成有活性的磷酸齐多夫定，以拮抗其作用。

利多卡因 Lidocaine

（1）与西咪替丁以及 β 受体拮抗药如普萘洛尔、美托洛尔、纳多洛尔合用时，本品经肝脏代谢受抑制，血浓度增加，可发生心脏和神经系统不良反应，应调整剂量，并应心电图监护及监测其血浆药物浓度。（2）巴比妥类药物可促进利多卡因代谢，两药合用可引起心动过缓，窦性停搏。（3）与普鲁卡因胺合用，可产生一过性谵妄及幻觉，但不影响本品血浆药物浓度。（4）异丙肾上腺素因增加肝血流量，可使本品的总清除率升高；去甲肾上腺素因减少肝血流量，可使本品总清除率下降。

利伐沙班 Rivaroxaban

（1）利伐沙班与酮康唑（一次 400 mg，一日 1 次）或利托那韦（一次 600 mg，一日 2 次）合用时，使利伐沙班的平均药时曲线下面积升高 2.6 和 2.5 倍，利伐沙班的平均血浆峰浓度升高 1.7 倍和 1.6 倍，同时药效显著提高，可能导致出血风险升高。因此，不建议将利伐沙班与抗真菌药（酮康唑、伊曲康唑、伏立康唑和泊沙康唑）或 HIV 蛋白酶抑制药合用。（2）与克拉霉

素（一次500 mg，一日2次）使利伐沙班的平均药时曲线下面积升高了1.5倍，使峰浓度升高1.4倍，但并不视为具有临床相关性。与红霉素（一次500 mg，一日3次）合用，使利伐沙班的平均药时曲线下面积和峰浓度升高1.3倍。以上升高并不视为具有临床相关性。(3) 依诺肝素并不影响利伐沙班的药动学。如患者同时接受任何其他抗凝血药治疗，由于出血风险升高，应特别谨慎。(4) 与非甾体抗炎药（包括阿司匹林）和抗血小板药合用时，应小心使用，因为这些药物通常会提高出血风险。(5) 与强效CYP3A4诱导药利福平合用，使利伐沙班的平均药时曲线下面积下降约50%，同时药效也平行降低。与其他强CYP3A4诱导药（苯妥英钠、卡马西平、苯巴比妥或圣约翰草）合用，也使利伐沙班血浆药物浓度降低。合用时应谨慎。

利福平 Rifampicin

（1）本品为肝药酶诱导药，与双香豆素衍生物、美沙酮、维拉帕米、糖皮质激素、地西泮、氯氮䓬、苯巴比妥、口服避孕药、口服降血糖药、洋地黄毒苷等合用时，可使代谢加速，血药浓度降低。与异烟肼合用可加速后者的代谢，使代谢物积聚而加重对肝脏的损害。（2）对氨水杨酸可影响利福平的吸收，导致血浆浓度降低，两者同用至少间隔6小时；与乙胺丁醇合用可增加视力损害，与乙硫异烟胺合用可加重其不良反应。（3）与多黏菌素合用，对沙雷菌属和变形菌属有协同作用；与红霉素和万古霉素合用对葡萄球菌包括耐甲氧西林的菌株有协同作用；与氨苄西林合用对李斯特菌属有增强作用；与甲氧苄啶合用，对溶血性链球菌、粪肠球菌、淋球菌、流感嗜血杆菌、摩根杆菌有协同作用，对产气杆菌、其他肠杆菌科细菌、铜绿假单胞菌杆菌、鼠伤寒杆菌及脆弱类杆菌有协同或相加作用。（4）丙磺舒可与本品竞争被肝细胞摄入，减慢本品的代谢和排泄，使其血浆浓度升高产生毒性反应。合用抗酸药可使本品的生物利用度明显降低。（5）利福平可刺激雌激素的代谢或减少其肠肝循环，降低避孕药的作用，或导致月经不规则，月经期间出血和计划外妊娠，应改用其他避孕方法。（6）利福平可增加抗肿瘤药达卡巴嗪、环磷酰胺的代谢，烷化代谢物的形成，促使白细胞减低，需调整剂量。（7）利福平可增加甲氧苄啶的消除，并增加黄嘌呤的代谢，使茶碱的清除率增加。

利培酮 Risperidone

（1）与乙醇或其他具有中枢抑制作用的药物合用，中枢抑制作用可互相增强。（2）与抗高血压药合用可增强本品的低血压效应。（3）可拮抗左旋多巴与多巴胺受体的激动作用。（4）长期与氯氮平合用可减少本品自体内清除。（5）卡马西平及其他肝药酶诱导剂会降低本品的血浆浓度。（6）吩噻嗪类抗精神病药、三环抗抑郁药和一些β受体拮抗药可增加本品血药浓度。

利塞膦酸钠 Sodium Risedronate

与钙剂、抗酸药及含二价阳离子的口服药合用，可影响本品的吸收。

利托君 Ritodrine

（1）避免与β受体激动药和抑制药同时使用。（2）同时使用皮质类激素可导致肺水肿（严重者可致死亡）。（3）与硫酸镁、二氮嗪、哌替啶、强效麻醉药合用可加重对心血管的影响，特别是心律失常或低血压。（4）与副交感神经阻滞药如阿托品合用可导致高血压。（5）可增强拟交感神经类药品不良反应或导致心律失常。

利托那韦 Ritonavir

（1）可能使阿夫唑嗪、NSAID、右丙氧芬、美沙酮、胺碘酮、氟卡尼、普罗帕酮、丙吡胺、美西律、大环内酯类抗生素、利福布汀、夫地西酸、SSRI、三环抗抑郁药、甲苯磺丁脲、卡马西平、伊曲康唑、第二代抗组胺药、抗焦虑药、抗精神病药、催眠药、地高辛、钙通道阻滞药、环孢素、伐地那非等的血药浓度升高。（2）可能增强或减弱华法林的抗凝作用，可能使香豆素类与苯茚二酮的抗凝作用增强。

附录

(3) 与曲唑酮合用不良反应增强。(4) 氟康唑使本品的血浆药物浓度升高。(5) 达非那新、托特罗定避免与本品合用。(6) 使安普那韦、茚地那韦、沙奎那韦的血药浓度升高；利托那韦使依法韦恩的毒性增强，应监测肝功能；利托那韦与奈非那韦合用可能使至少一种药物的血浆药物浓度升高。(7) 可能使波生坦的血药浓度升高。(8) 使安非他酮的血浆药物浓度升高，避免与乐卡地平合用。(9) 可能使西洛他唑、糖皮质激素类、地塞米松及泼尼松龙的血药浓度升高；利托那韦使布地奈德、氟替卡松（吸入或鼻腔给药）的血药浓度升高。(10) 使紫杉醇、依普利酮的血药浓度升高。(11) 与麦角胺合用增加麦角中毒发生的危险性。(12) 与阿托伐他汀、辛伐他汀合用增加肌病的发生。(13) 促进雌激素和茶碱的代谢。

利血平 Reserpine

(1) 乙醇、中枢神经抑制药、巴比妥类：可加重本品中枢抑制作用。(2) 其他抗高血压药：可加强降压作用，需进行剂量调整。(3) 洋地黄：大剂量时可引起心律失常。(4) 左旋多巴：可使多巴胺耗竭，导致帕金森病。(5) 三环类抗抑郁药：本品与抗抑郁药作用均减弱。

链激酶 Streptokinase

(1) 与肝素合用，可抑制本品活性。(2) 与其他抗凝药合用，增加出血的危险，不宜合用。(3) 与非甾体抗炎药合用，有增加出血的危险。

链霉素 Streptomycin

(1) 与其他氨基糖苷类抗生素合用或先后连续应用，可增加其毒性。(2) 与神经肌肉阻滞药合用，可加重神经肌肉阻滞作用。(3) 与其他具有耳、肾毒性的药物合用，可增加耳毒性、肾毒性。与多黏菌素类合用可加重肾毒性和神经肌肉阻滞作用。

两性霉素 B Amphotericin B

(1) 和氨基糖苷类或多黏菌素类抗生素合用增加肾毒性；和万古霉素合用可能增加肾毒性。(2) 降低氟胞嘧啶的肾排泄，增加细胞摄取可能增加毒性；本品的作用可能被咪唑类和三唑类抗真菌药拮抗。(3) 由两性霉素 B 引起的低钾血症增加强心苷的心脏毒性。(4) 和环孢素合用增加肾毒性。(5) 和糖皮质激素类合用增加低钾血症的危险。(6) 和襻利尿药或噻嗪类及其相关利尿药合用增加低钾血症的危险。(7) 和喷他脒合用可能增加肾毒性。(8) 和他克莫司合用肾毒性增加。

林可霉素 Clindamycin

(1) 与吸入性麻醉药同用，神经肌肉阻断现象加强，导致骨骼肌松弛和呼吸抑制或麻痹（呼吸暂停），即使在术中或术后同用也应注意。(2) 与止泻药同用，可引起伴严重水样腹泻的伪膜性肠炎。因可使结肠内毒素延迟排出而导致腹泻延长和加剧，故抗蠕动止泻药不宜同用。(3) 林可霉素有神经-肌肉阻断作用，可减弱抗肌无力药的效果。为控制重症肌无力的症状，合用时抗肌无力药的剂量应予调整。(4) 氯霉素或红霉素可在靶位上置换林可霉素类而取而代之，或阻抑后者与细菌核糖体 50 s 亚基的结合，故不宜联合应用。(5) 林可霉素类的呼吸抑制作用与阿片类的中枢呼吸抑制作用，有相加或协同作用，同用时必须进行密切观察或监护。

磷霉素 Fosfomycin

与 β-内酰胺类、氨基糖苷类、大环内酯类、氟喹诺酮类抗菌药物合用，具有相加或协同作用，并减少耐药菌株的产生。

磷霉素氨丁三醇 Pulveres Fosfomycin

西咪替丁、甲硝唑可影响本品吸收，避免合用。

膦甲酸钠 Foscarnet Sodium

拉米夫定避免与膦甲酸钠合用。

硫必利 Tiapride

本品能增强中枢抑制药的作用，可与镇痛药、镇静药、催眠药、抗焦虑药、抗抑郁药、抗震颤麻痹药及抗癫痫药合用，

但在治疗开始时，应减少合用中枢抑制药剂量。

硫利达嗪 Thiordazine

（1）本品可增强镇痛药、催眠药、抗组胺药、麻醉药及乙醇的中枢抑制作用。（2）不宜与奎尼丁合用。（3）氟西汀、帕罗西汀、氟伏沙明、安非他酮、吲哚洛尔、普萘洛尔等药可抑制CYP2D6介导的本品代谢，增加本品的血浆药物浓度。（4）三环类抗抑郁药与本品合用，可相互干扰抗抑郁药代谢，导致其中一种药物的血药浓度升高。由于两类药都有抗胆碱能活性，可能存在抗胆碱能作用相加。

硫鸟嘌呤 Tioguanine

本品和抗痛风药同用需增加抗痛风药的剂量。与其他抗肿瘤药或放疗合用会增加本品的效应，但应调整本品剂量与疗程。

硫喷妥钠 Thiopental Sodium

（1）与抗高血压药并用时，适当减少本品用量并减慢注射速度，以免血压剧降。（2）甲氧氯普胺可加强本品的镇静作用。（3）本品与磺胺异噁唑合用可减少本品麻醉所需用量和缩短复苏时间。（4）与丙磺舒合用，可导致麻醉持续时间延长。(5)与吩噻嗪类药(尤其是异丙嗪)合用时，在血压下降过程中，中枢神经系统可先出现兴奋，后抑制现象。（6）本品可增加三环抗抑郁药的代谢，降低后者的血药浓度。

硫酸阿托品 Atropine Sulfate

三环类抗抑郁药、H_1受体拮抗药、抗帕金森病药、吩噻嗪类抗精神病药等均有抗胆碱作用，合用后可加重尿潴留、便秘、口干等阿托品样不良反应。

硫酸镁 Magnesium Sulfate

（1）同时静脉注射钙剂时，可减弱本品对神经肌肉的作用。（2）中枢神经抑制药：本品能加强如氯丙嗪、氯氮䓬等的作用。（3）其他神经肌肉阻滞药：合用时可致严重的神经肌肉传导阻滞。（4）洋地黄：已洋地黄化的患者在使用本品时可发生严重的心脏传导阻滞甚至心搏骤停，应高度重视。（5）本品与肾上腺素β受体激动药利托君等同时使用，易引起心血管的不良反应。（6）与氯氮䓬、氯丙嗪、双香豆素、地高辛或异烟肼等合用，上列药物的作用降低。

硫酸亚铁 Ferrous Sulfate

（1）维生素C与本品同服，有利于吸收。（2）磷酸盐类、四环素类及鞣酸等同服，可妨碍铁的吸收。（3）本品可减少左旋多巴、卡比多巴、甲基多巴及氟喹诺酮类药物的吸收。

硫酸锌 Zinc Sulfate

与铝、钙、锶、硼砂、碳酸盐和氢氧化物、蛋白银及鞣酸等有配伍禁忌。锌盐与青霉胺共用可使后者作用减弱。

硫糖铝 Sucralfate

（1）影响脂溶性维生素的吸收。（2）影响多种药物的消化道吸收，如氟喹诺酮类药物。（3）与多酶片合用时，两者疗效均降低。(4)抗酸药可干扰硫糖铝的药理作用。（5）不宜与碱性药合用。（6）抗胆碱药可缓解硫糖铝所致的便秘和胃部不适等不良反应。

硫唑嘌呤 Azathioprine

（1）多柔比星可增强本品的肝毒性，合用亦可导致多柔比星排泄延迟，从而造成严重骨髓抑制。（2）与氯喹合用可加重骨髓毒性。（3）与环孢素合用能减少环孢素的吸收。（4）与卡托普利合用，白细胞明显减少。（5）与别嘌醇或巯嘌呤合用，本品用量一般要减少3/4。（6）可降低华法林的抗凝作用。（7）与糖皮质激素合用治疗多发性肌炎、皮肌炎、韦氏肉芽肿病等时，能减少糖皮质激素的用量和不良反应，但继发感染的发生率亦增加。（8）与泼尼松合用可改善毛细血管功能、减轻免疫抑制药的不良反应，使慢性血小板减少性紫癜改善，但易致消化道出血。（9）本品可增强去极化药物的神经阻滞作用，削弱非除极化型肌松药的作用。（10）尽量避免并用细胞生长抑制药和骨髓抑制药。

柳氮磺吡啶 Sulfasalazine

（1）与尿碱化药合用可增强磺胺药在碱性尿中的溶解度，使排泄增多。（2）对氨基苯甲酸可代替磺胺被细菌摄取，对磺胺药的抑菌作用发生拮抗，因而两者不宜合用。（3）下列药物与磺胺药合用时，后者可取代这些药物的蛋白结合部位，或抑制其代谢，以致药物作用时间延长或毒性发生，因此当这些药物与磺胺药合用，或在应用磺胺药之后使用时需调整其剂量。此类药物包括口服抗凝药、口服降糖药、甲氨蝶呤、苯妥英钠和硫喷妥钠。（4）骨髓抑制药与磺胺药合用时，可能增强此类药物对造血系统的不良反应。如有指征需两类药物合用时，应严密观察可能发生的毒性反应。（5）避孕药（雌激素类），长时间与磺胺药合用可导致避孕的可靠性减少，并增加经期外出血的机会。（6）溶栓药与磺胺药合用时，可能增大其潜在的毒性作用。（7）肝毒性药物与磺胺药合用，可能引起肝毒性发生率的增高。应监测肝功能。（8）光敏药物与磺胺药合用可能发生光敏的相加作用。（9）接受磺胺药治疗者对维生素 K 的需要量增加。（10）乌洛托品在酸性尿中分解产生甲醛，后者可与磺胺形成不溶性沉淀物。使发生结晶尿的危险性增加，因此两药不宜合用。（11）磺吡酮与磺胺药同用时可减少后者自肾小管的分泌，其血浆药物浓度升高且持久，从而产生毒性，因此，在应用磺吡酮期间或在其治疗后可能需要调整磺胺药的剂量。当磺吡酮疗程较长时，对磺胺药的血浆药物浓度宜进行监测，有助于剂量的调整，保证安全用药。（12）与洋地黄类或叶酸合用时，后者吸收减少，血浆药物浓度降低，因此须随时观察洋地黄类的作用和疗效。（13）与丙磺舒合用，会降低肾小管磺胺排泌量，致磺胺的血浆药物浓度上升，作用延长，容易中毒。（14）与新霉素合用，新霉素抑制肠道菌群，影响本品在肠道内分解，使作用降低。

六甲蜜胺 Altretamine

与单胺氧化酶抑制药、抗抑郁药合用可导致严重的直立性低血压；与甲氧氯普胺合用可致肌张力障碍。与维生素 B_6 同时使用，可能减轻周围神经毒性。

咯萘啶 Malaridine

（1）与磺胺多辛、乙胺嘧啶合用可增强本品疗效，延缓抗药性的产生。（2）与伯氨喹合用，有较好的根治间日疟作用。

铝碳酸镁 Hydrotalcite

（1）酸性药及酸性饮料可降低其抗酸作用。（2）干扰其他药物吸收。

氯胺酮 Ketamine Hydrochloride

（1）氯胺酮与苯二氮䓬类及阿片类药并用时，可延长作用时间并减少不良反应的发生，剂量应酌情减少。（2）与氟烷等含卤素全麻药同用时，氯胺酮的作用延长，苏醒迟延。（3）服用甲状腺素的患者，氯胺酮有可能引起血压过高和心动过速。

氯苯那敏 Chlorphenamine

（1）与解热镇痛药物同用，可增强其镇痛和缓解感冒症状的作用。（2）与中枢镇静药、催眠药、地西泮或乙醇并用，可增加对中枢神经的抑制作用。（3）本品可增强抗抑郁药的作用。

氯吡格雷 Clopidogrel

（1）与华法林合用，能增加出血危险。（2）与糖蛋白Ⅱb/Ⅲa 拮抗药在创伤、外科或其他有出血倾向患者慎用。（3）与阿司匹林、肝素、溶栓药合用使出血危险增加。（4）与非甾体抗炎药（NSAID）合用使胃肠道隐性出血增加。（5）与苯妥英钠、甲苯磺丁脲、NSAID 等通过肝酶 CYP2C9 代谢的药物合用，血浆药物浓度增加。（6）质子泵抑制药可降低本品抗血小板作用。

氯丙那林 Clorprenaline Hydrochloride

（1）与其他 β_2 受体激动药同用有相加作用，但不良反应也增加。（2）与抗胆碱药或茶碱类药并用，其扩张支气管、缓解哮喘的效果增强。

氯丙嗪　Chlorpromazine

(1) 与中枢神经系统抑制药，如乙醇、麻醉药、抗焦虑药、镇静药以及催眠药合用，中枢神经的抑制作用加强。(2) 抗酸药可抑制本品的口服吸收，应至少在本品用药前1小时或用药后2小时服用。(3) 与抗惊厥药合用，降低后者的抗惊厥作用。(4) 与三环类抗抑郁药及抗胆碱能药合用时，抗胆碱能作用相互加强。(5) 与肾上腺素合用时，对抗其升压作用，可导致低血压和心动过速。(6) 与左旋多巴、美金刚、溴隐亭合用时，本品可对抗其抗震颤麻痹作用。(7) 与抗高血压药并用易致直立性低血压。(8) 与胺碘酮、普鲁卡因胺、匹莫齐特、阿托西汀等合用，增加发生室性心律失常的风险。(9) 与碳酸锂合用，增加锥体外系反应的发生率，并可能具有神经毒性。(10) 与普萘洛尔合用，增加两者的血浆药物浓度。(11) 与苯巴比妥类合用，降低两者的血浆药物浓度。

氯氮平　Clozapine

(1) 与乙醇或其他中枢神经抑制药合用，可显著加重中枢抑制作用。(2) 增强其他抗胆碱作用药物的抗胆碱作用。(3) 与卡马西平合用，可增加对骨髓的抑制作用，并可使本品血药浓度降低。(4) 与地高辛、肝素、苯妥英钠、华法林合用，可加重骨髓抑制作用。(5) 与碳酸锂合用，可增加产生惊厥、恶性综合征、精神错乱及肌张力障碍的危险。(6) 与氟伏沙明、氟西汀、帕罗西汀、文拉法辛等抗抑郁药合用可升高本品的血浆药物浓度。(7) 与降血压药合用可能有增加直立性低血压的风险。(8) 与大环内酯类抗生素合用可使本品血药浓度增加，并有诱发癫痫的报道。

氯琥珀胆碱　Suxamethonium

(1) 下列药物可降低假性胆碱酯酶活性，而增强本品的作用：①抗胆碱酯酶药；②环磷酰胺、氮芥、塞替哌等；③普鲁卡因等局麻药；④单胺氧化酶抑制药、雌激素等。(2) 吩噻嗪类、普鲁卡因胺、奎尼丁、卡那霉素、多黏菌素B、新霉素等能增强本品作用。

氯化钙　Calcium Chloride

(1) 与雌激素同用，可增加钙的吸收。(2) 与噻嗪类利尿药同用，增加肾脏对钙的重吸收，可致高钙血症。

氯化钾　Potassium Chloride

(1) 糖皮质激素和促肾上腺皮质激素(ACTH)能促进尿钾排泄，降低钾盐疗效。(2) 抗胆碱药能加剧氯化钾的胃肠道刺激作用。(3) 非甾体抗炎药加剧钾盐的胃肠道反应。(4) 合用库存血、含钾药物和留钾利尿药时，发生高钾血症的机会增多，尤其是有肾损害者。(5) 与血管紧张素转换酶抑制药和环孢素合用时易发生高钾血症。(6) 与肝素合用时易发生高钾血症。(7) 缓释型钾盐能抑制肠道对维生素B_{12}的吸收。

氯喹　Chloroquine

(1) 本品对神经肌肉接头有直接抑制作用，链霉素可加重此不良反应。(2) 洋地黄化后应用本品易引起心脏传导阻滞。(3) 与肝素或青霉胺合用，可增加出血机会。(4) 与伯氨喹合用部分患者可出现严重心血管的不良反应。(5) 与氯化铵合用，可加速本品排泄而降低血中浓度。(6) 与单胺氧化酶抑制药合用可增加毒性。(7) 与泼尼松龙合用易致剥脱性红皮病。(8) 与氯喹同类物（氨酚喹、羟氯喹等）同用，可使氯喹血浆浓度提高。(9) 与氯丙嗪合用加重对肝脏的损害。(10) 西咪替丁可使氯喹的代谢及消除半衰期延长。

氯膦酸二钠胶囊　Clodronate Disodium

本品不应与牛奶、食物或含钙和其他二价阳离子的药物同服，因可影响本品的吸收。

氯马斯汀　Clemastine

同用可增强乙醇、中枢神经抑制药和抗胆碱药的作用。

氯霉素　Chloramphenicol

(1) 利福平能加速氯霉素的代谢；林可霉素、红霉素类可替代或阻止本品与细

菌核糖体 50 s 亚基的结合，两者同用可发生拮抗作用。(2) 氯霉素能增强香豆素类的抗凝血作用。(3) 氯霉素能够增强磺酰脲类药的作用。(4) 与甲苯磺丁脲等降糖药同用，由于蛋白结合部位被替代，可增强后者的降糖作用，须调整降糖药的剂量，格列吡嗪和格列本脲的蛋白结合率较小，故发生相互作用较少，但合用时仍需谨慎。(5) 氯霉素能增高苯妥英钠的血药浓度，毒性发生的危险性增加；扑米酮能够加速氯霉素的代谢。(6) 避免将氯霉素与氯氮平合用，增加粒细胞缺乏症的危险性。(7) 巴比妥类药能加速氯霉素的代谢。(8) 氯霉素可能增高环孢素的血药浓度。(9) 氯霉素可拮抗维生素 B_{12} 的造血作用，降低对维生素 B_{12} 的敏感性，两者不宜同用。本品具有拮抗维生素 B_6 的作用，使后者经肾脏的排泄量增加，可致贫血或诱发周围神经炎，此时宜补充维生素 B_6。(10) 氯霉素能延缓铁、叶酸、维生素 B_{12} 对贫血的治疗反应。

氯美扎酮 Chlormezanone

(1) 与阿司匹林、哌替啶等合用，可增强镇痛作用。(2) 本品可增强其他中枢神经系统药，如镇静催眠药等的中枢抑制作用。(3) 乙醇可加强本品的中枢作用，服药期间应避免饮酒。

氯米芬 Clomifene

达那唑（抑制作用）；抑制炔雌醇作用；与醋酸戈那瑞林联合使用可引起卵巢过度刺激。

氯米帕明 Clomipramine

(1) CYP 抑制药可抑制本品的代谢，使血浓度增加，引起不良反应。(2) CYP 诱导剂可增强本品的代谢，使血浓度降低，影响药物疗效。(3) 本品可降低抗凝药（如双香豆素、华法林）的代谢，增加出血的危险。(4) 本品可抑制苯妥英钠的代谢，使后者的血浓度升高，从而增加苯妥英钠的不良反应（如共济失调、反射亢进、眼球震颤等）。(5) 与 5-HT 受体激动药合用，可产生 5-HT 综合征。(6) 与乙醇合用，可加重中枢神经的抑制作用。(7) 与抗癫痫药合用，可降低癫痫阈值，从而降低抗癫痫药的作用。(8) 与抗组胺药或抗胆碱药合用，药效相互加强。(9) 与可乐定合用，后者的抗高血压作用降低。(10) 与雌激素或含雌激素的避孕药合用，可增加本品的不良反应，同时降低抗抑郁作用。(11) 与单胺氧化酶抑制药合用，可产生高血压危象，且已有死亡的报道。(12) 与肾上腺素受体激动药合用，可引起严重高血压与高热。(13) 与甲状腺制剂合用，可相互增效，导致心律失常。

氯诺昔康 Lornoxicam

(1) 本品与其他非甾体抗炎药合用，不一定提高疗效，但不良反应增加。(2) 阿司匹林使本品的 C_{max}、AUC 和清除半衰期减少 20%；本品使阿司匹林的 C_{max}、AUC 和清除半衰期减少 6% ~ 15%，且不良反应增强。(3) 铋的螯合物使本品生物利用度降低。(4) 西咪替丁可抑制本品代谢。(5) 地高辛使本品的 C_{max} 和清除半衰期增加，而地高辛的肾清除率减少。(6) 本品可拮抗血管紧张素转换酶抑制药的降压作用；通过血浆蛋白置换增强磺酰脲类降糖药和华法林的作用。(7) 本品可减少锂的清除；抑制肾前列腺素的合成，可使呋塞米效果减弱。本品可使甲氨蝶呤排泄减少。

氯普噻吨 Chlorprothixene

(1) 氯普噻吨能加强中枢抑制药，例如吸入全麻药或巴比妥类等静脉全麻药的药效，合用时应将中枢抑制药的用量减少到常用量的 1/4 ~ 1/2。(2) 与苯丙胺合用，可降低后者的效应。(3) 并用抗胃酸药或泻药时，可减少氯普噻吨的吸收。(4) 可降低惊厥阈值，因而使抗惊厥药作用减弱，不宜用于癫痫患者。(5) 抗胆碱药物并用时，抗胆碱作用可加强。(6) 肾上腺素并用，由于本品阻断 α 受体，显示出肾上腺素激动 β 受体的效应，导致血压降低。(7) 胍乙啶并用，可减低胍乙啶的抗高血压作用。(8) 左旋多巴并用，可抑制后者的抗帕金森病作用。(9) 环类或单胺氧化酶抑制药与氯普噻吨并用，镇静及抗胆碱作用可更显著。(10) 可掩盖某些抗生素

的耳毒性。

氯噻酮 Chlortalidone

（见氢氯噻嗪）

氯沙坦 Lossartan

（1）利福平和氟康唑可降低本品活性代谢产物水平。（2）留钾利尿药、钾盐或含钾盐代用品合用时，可致血钾升高。（3）血管紧张素Ⅱ受体拮抗药的抗高血压作用可能会被非甾体抗炎药（包括 COX-2 抑制药）削弱；有肾功能损害的患者同时服用非甾体抗炎药和血管紧张素Ⅱ受体拮抗药可能导致进一步的肾功能损害。

罗格列酮 Rosiglitazone

本品主要经 CYP2C8 代谢，与该酶抑制药如吉非贝齐合用，可能升高本品血浆药物浓度；与该酶诱导药如利福平合用则降低本品血浆药物浓度。

罗库溴铵 Rocuronium Bromide

（1）增强作用：麻醉药氟烷、乙醚、异氟醚、甲氧氟醚、环丙烷。大剂量硫喷妥钠、巴比妥钠、氯胺酮、芬太尼、γ-羟基丁酸钠、依托醚酯及异丙酚等。其他非去极化肌松药。氨基糖苷类和多肽类抗生素、酰胺类青霉素、大剂量甲硝唑。利尿药、β 受体拮抗药、维生素 B_1、单胺氧化酶抑制药、奎尼丁、鱼精蛋白、α 受体拮抗药、镁盐等。（2）减弱作用：新斯的明、依酚氯铵、溴吡斯的明。长期应用皮质激素、苯妥英钠、卡米西平。去甲肾上腺素、硫唑嘌呤（仅短暂和有限的作用）、茶碱、氯化钙等。

罗哌卡因 Ropivacaine

（1）同时应用其他局麻药或与酰胺类局麻药结构相关的药物治疗的患者如同时使用本品应慎用。（2）与第Ⅲ类抗心律失常药（如胺碘酮）合用时应谨慎。

螺内酯 Spironolactone

（1）糖皮质激素、促肾上腺皮质激素能减弱本品的利尿作用，拮抗本品的潴钾作用。（2）与血管紧张素转换酶抑制药合用可增加发生高钾血症的机会。（3）雌激素能减弱本品的利尿作用。（4）非甾体抗炎药能降低本品的利尿作用，合用时肾毒性增加。（5）拟交感神经药物可降低本品的降压作用。（6）可使本品利尿和降压效果加强。（7）与葡萄糖胰岛素液合用：发生高钾血症的机会减少。（8）本品使地高辛半衰期延长。（9）氯化铵：易发生代谢性酸中毒。（10）与具有肾毒性药物合用使肾毒性增加。（11）与含钾药物不宜合用。（12）与甘草类制剂有拮抗作用，不宜同用。

洛伐他汀 Lovastatin

（1）口服抗凝药：合用可使凝血酶原时间延长，使出血的危险性增加。（2）环孢素、阿奇霉素、克拉霉素、红霉素、达那唑、伊曲康唑、吉非贝齐、烟酸：合用可增加横纹肌溶解和急性肾衰竭发生的危险。（3）考来替泊、考来烯胺：合用可使本品的生物利用度降低，故应在服用前者4小时后服用本品。

洛莫司汀 Lomustine

（1）与西咪替丁合用，骨髓抑制可能加重。（2）正在接受化疗的患者不能接种活疫苗。缓解期白血病患者，至少要停止化疗3个月后才能接种活疫苗。（3）以本品组成联合化疗方案时，应避免合用有严重降低白细胞和血小板的抗癌药。

洛美沙星 Lomefloxacin

(1) 本品对茶碱类药物和咖啡因的肝内代谢、体内清除过程影响小。(2) 硫糖铝和抗酸药可使本品吸收速率减慢 25%，药时曲线下面积（AVC）降低约 30%，如在本品服用前4小时或服用后6小时服硫糖铝和抗酸药则影响甚微。(3) 与芬布芬合用可致中枢兴奋、癫痫发作。(4) 丙磺舒可延迟本品的排泄，使平均药时曲线下面积（AVC）增加 63%，平均达峰时间延长 50%，平均峰浓度增高 4%，故合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。(5) 本品可加强口服抗凝血药如华法林等的作用，应监测凝血酶原时间。(6) 尿碱化药可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。(7) 制剂中含铝及镁可

与喹诺酮类螯合，不宜合用。(8) 与环孢素合用，可使环孢素血浆药物浓度升高，必须监测环孢素血浆浓度，并调整剂量。(9) 服用本品前后 2 小时内不宜服用含金属离子药或营养剂和复方维生素。

洛索洛芬　Loxoprofen

(1) 本品与香豆素类抗凝药（华法林）合用，可增强该类药的抗凝作用（因本品抑制前列腺素的生物合成，从而抑制血小板聚集，降低血液凝固力，对抗凝血药起相加作用）。(2) 与磺酰脲类降糖药（甲苯磺丁脲等）合用时，会增强降血糖作用。(3) 与蛋白结合率高的药物合用时，会增加合用药物的血中游离浓度，增强该药的作用。(4) 与氟喹诺酮类抗菌药合用，可能增强诱发痉挛作用。(5) 与锂盐合用，可使血中锂浓度上升而引起锂中毒。(6) 与噻嗪类利尿药合用，可能减弱其利尿降压作用。

马普替林　Maprotiline

(1) 与抗组胺药合用，可增强抗胆碱作用，合用时宜调整两者的剂量。(2) CYP 抑制药可增加本品血浓度，如与西咪替丁合用，应调整剂量。(3) CYP 诱导剂可降低本品血浓度，影响疗效。(4) 与可乐定合用时可降低后者的抗高血压作用。(5) 与单胺氧化酶抑制药合用易引起 5-HT 综合征。(6) 与甲状腺激素合用可增加心律失常的危险性，应调整剂量。(7) 本品可增加癫痫发作的危险性，使抗癫痫药的疗效降低。(8) 与麻醉药、肌松药巴比妥类和苯二氮䓬类等镇静催眠药、吩噻嗪类、三环类抗抑郁药、镇痛药等合用可导致过度嗜睡。

吗啡　Morphine

(1) 不可与单胺氧化酶抑制药并用，且单胺氧化酶抑制药停用 2 周内也不可使用。(2) 吩噻嗪类、镇静药、一般麻醉药、三环抗抑郁药、抗组胺药可增强本品的中枢抑制作用。(3) 可增强香豆素类的抗凝血作用。(4) 与西咪替丁合用可引起呼吸暂停、精神错乱、肌肉抽搐。

吗氯贝胺　Moclobemide

(1) CYP 抑制药可抑制本品的代谢，使血药浓度增加，引起不良反应。(2) CYP 诱导药可增强本品的代谢，使血浓度降低，可影响药物疗效。(3) 与加强单胺类神经功能药物合用，可出现高血压危象或 5-HT 综合征等严重不良反应。(4) 与乙醇合用能使精神和运动技能损害的危险性增加。

吗替麦考酚酯　Mycophenolate mofetil

(1) 本品不能与硫唑嘌呤同时使用。(2) 已注意到考来烯胺能显著减少 MPA 曲线下面积。不应与吗替麦考酚酯胶囊同时服用能干扰肝肠循环的药物合用，因这些药物可能会降低吗替麦考酚酯胶囊的药效。(3) 阿昔洛韦：MMF 与阿昔洛韦同时服用时，MPAG 和阿昔洛韦的血浆浓度较两种药物单独服用时为高。当肾功能损害时，MPAG 和阿昔洛韦的血浆浓度都升高，这两种药物竞争性的通过肾小管排出，可能会进一步增高两种药物血浆浓度。(4) 抗酸药和氢氧化镁以及氢氧化铝：可使 MMF 的吸收减少。(5) 考来烯胺：健康人先期服用考来烯胺 4 g 一日 3 次，4 日后，给予单剂量 MMF1.5 g，MPA 的曲线下面积减少 40%。(6) 口服避孕药：目前未发现 MMF 和口服避孕药 1 mg 炔诺孕酮 /35 mg 炔雌醇之间有相互影响，但这仅是单次剂量研究的结论，并不能排除长期服用考来烯胺胶囊后改变口服避孕药的药动学的可能性，这可能导致口服避孕药的药效降低。(7) 其他：给猴子同时服用丙磺舒和 MMF，可使血浆 MPAG 曲线下面积增加 3 倍。为此，其他经肾小管排出的药物，可以与 MPAG 竞争，从而使血浆 MPAG 或这些药物的浓度升高。(8) 对有免疫反应障碍的病人不应接种活疫苗。对其他接种的抗体反应可能被清除。(9) 磺吡酮、丙磺舒可能干扰本品由肾小管分泌，合用时可使本品毒性增加。

麦迪霉素　Midecamycin

不宜与 β-内酰胺类抗生素联合应用。本品可降低氯霉素、林可霉素、克林霉素的抗菌作用，不宜合用。

麦角胺咖啡因 Ergotamine and Caffeine

本品与β受体拮抗药、大环内酯类抗生素、血管收缩剂和5-羟色胺激动药等有相互协同作用。

麦考酚钠 Mycophenolate Sodium

(1)活疫苗不能用于免疫反应低下的患者。对其他疫苗的抗体反应也可能会削弱。(2)与阿昔洛韦合用，在肾功能不全时可能出现MPAG(麦考酚酸葡萄糖醛酸苷)和阿昔洛韦的血浆浓度升高。因此，可能存在这两种药物的肾小管分泌竞争，导致MPAG和阿昔洛韦浓度的进一步升高。在此种情况下，患者应当接受仔细的追踪观察。(3)与含有镁和铝氢氧化物的抗酸药合用，会减少麦考酚酯钠盐的吸收。麦考酚钠和含有镁和铝氢氧化物的抗酸药联合使用会导致麦考酚酸(MPA)整体暴露量降低37%和麦考酚酸(MPA)最大浓度降低25%。当麦考酚钠与抗酸药(含有镁和铝氢氧化物)联合使用时应谨慎。(4)与考来烯胺和其他干扰肝肠循环的药物合用，由于具有阻断药物肠循环的作用，考来烯胺可能会降低麦考酚酸(MPA)的整体暴露量。与考来烯胺和其他干扰肝肠循环的药物联合用药时可能会降低麦考酚钠的效果，应谨慎使用。(5)对肾功能不全者合用麦考酚钠和更昔洛韦时，应当仔细观察更昔洛韦的推荐剂量和进行患者监护。(6)与他克莫司合用，麦考酚酸的平均药时曲线下面积提高19%，峰浓度降低大约20%。(7)口服避孕药经过氧化代谢，而麦考酚钠经过葡萄糖苷酸化代谢。临床上口服避孕药应不会对麦考酚钠药动学产生影响。然而，尚不知道麦考酚钠对口服避孕药药动学的长期影响，口服避孕药的有效性有可能会受到不利影响。

毛果芸香碱 Pilocarpine

(1)与肾上腺素受体拮抗药、碳酸酐酶抑制药、肾上腺素能受体激动药或高渗脱水剂合用有协同作用。(2)与拉坦前列素合用可降低经葡萄膜巩膜途径房水的排出。(3)与眼局部应用的抗胆碱药合用可干扰本品作用。

美法仑 Melphalan

与环磷酰胺合用可引起肾功能损伤。本品可引起血尿酸增加，别嘌醇可防止或缓解本品所引起的高尿酸血症。

美金刚 Memantine

(1)左旋多巴、多巴胺受体激动药、抗胆碱能药、巴比妥类、丹曲林、巴氯芬与NMDA拮抗药合用需调整剂量。(2)避免与金刚烷胺、右美沙芬、氯胺酮合用。(3)与其他由肾脏阳离子转运的药物合用可能导致血浆药物浓度上升。(4)与氢氯噻嗪合用可能导致血浆药物浓度下降。

美罗培南 Meropenem

(1)美罗培南与丙戊酸钠合用可使后者的血浆药物浓度降低。(2)丙磺舒能抑制美罗培南的排泄。(3)与氨基糖苷类抗生素合用，对某些铜绿假单胞菌的分离菌株，可产生协同作用。

美洛昔康 Meloxicam

(1)与大剂量NSAID包括水杨酸盐同时使用可增加胃肠道溃疡及出血的可能性。(2)与口服抗凝药、肝素、溶栓剂合用，可增加出血的可能。如果上述合并用药不可避免，必须密切监视抗凝药的作用。(3)本品可增加锂盐的血浆药物浓度，建议在开始使用、调节和停用美洛昔康片时监控血浆锂盐水平。(4)美洛昔康会增加甲氨蝶呤的血液毒性。(5)可能使因利尿脱水患者发生急性肾功能不全，故使用美洛昔康片和利尿药的病人应补充足够的水，在治疗开始前还应监控肾功能。(6)与抗高血压药(β受体拮抗药、ACEI、血管舒张药、利尿药)合用，有报道在应用NSAID治疗期间，通过抑制血管舒张作用的前列腺素使抗高血压药作用降低。(7)通过肾前列腺素间接的作用NSAID会提高环孢素的肾毒性，在合用治疗期间要测定肾功能。

美沙拉秦 Mesalazine

(1)与抗凝药合用，可加强抗凝药的作用(增加胃肠道出血的倾向)。(2)与

糖皮质激素合用，可增加胃的不良反应。(3) 与磺酰脲类降糖药合用，可加剧低血糖反应。(4) 与甲氨蝶呤合用，可能增加甲氨蝶呤的毒性。(5) 与丙磺舒或磺吡酮合用，可降低排尿酸作用。(6) 与呋塞米和螺内酯合用，可减弱利尿作用。(7) 与利福平合用，可减弱抗结核作用。

美沙酮 Methadone

苯妥英钠和利福平等能促使肝细胞微粒体酶的活动增强，因而本品在体内的降解代谢加快，用量应相应增加。

美托洛尔 Metoprolol

(1) 西咪替丁、奎尼丁均可增加美托洛尔的血浆浓度。(2) 利血平：合用可增强本品作用。(3) 维拉帕米：心动过缓、低血压和心脏停搏，不宜合用。

美西律 Mexiletine

(1) 肝酶诱导剂：降低美西律的血浆药物浓度。(2) 吗啡：在急性心肌梗死早期，使本品吸收延迟并减少。(3) 抗酸药：可减低口服时的血浆药物浓度。(4) 西咪替丁：增加本品血浆药物浓度。(5) 止吐药：增加本品吸收速度。

门冬氨酸钾镁 Potassium Aspartate and Magnesium Aspartatse

(1) 本品能抑制四环素、铁盐、氟化钠的吸收。(2) 与补钾性利尿药和（或）血管紧张素转换酶抑制药(ACEI)配伍时，可能发生高钾血症。

门冬酰胺酶 Asparaginase

(1) 本品与泼尼松、促肾上腺皮质激素或长春新碱同用，可增强本品的致高血糖作用。(2) 本品可增高血尿酸浓度，与别嘌醇等抗痛风药合用应调整剂量。(3) 与其他化疗药物和放疗同用应减量。

门冬胰岛素 Insulin Aspart

(1) 口服降糖药、奥曲肽、单胺氧化酶（MAO）抑制药、非选择性 β-肾上腺素阻滞药，血管紧张素转换酶抑制药、水杨酸盐、乙醇、维生素 B_1 类制剂。可能会减少胰岛素需要量。(2) 可能会增加胰岛素需要量的药物：口服避孕药，噻嗪类利尿药，糖皮质激素，甲状腺激素，交感神经兴奋剂和达那唑。β 受体拮抗药可掩盖低血糖的症状。乙醇可以加剧和延长胰岛素的低血糖作用。

孟鲁司特 Montelukast

合用支气管扩张药物治疗时，可减少支气管扩张药剂量。

咪达唑仑 Midazolam

(1) 咪达唑仑可增强催眠药、镇静药、抗焦虑药、抗抑郁药、抗癫痫药、麻醉药和镇静性抗组胺药的中枢抑制作用。(2) 一些肝酶抑制药，特别是 CYP3A 抑制药物，可影响咪达唑仑的药动学，使其镇静作用延长。(3) 乙醇可增强咪达唑仑的镇静作用。

咪唑斯汀 Mizolastine

(1) 慎与西咪替丁、环孢素或硝苯地平联合使用。(2) 与大环内酯类抗生素或全身用咪唑类抗真菌药合用，可使本品血浆浓度中度升高。

米氮平 Mirtazapine

(1) 与单胺氧化酶抑制药合用易引起 5-HT 综合征。(2) 可加重乙醇对中枢的抑制作用，因此在治疗期间应禁止饮酒。(3) 可能加重苯二氮䓬类药的镇静作用，两者合用时应予以注意。

米多君 Midodrine

(1) 应当避免与拟交感神经药或其他血管收缩药，如利血平、胍乙啶、三环类抗抑郁药、抗组胺药、甲状腺激素和单胺氧化酶抑制药同时使用，因为可能发生血压的显著升高。(2) 本品的作用可能受到 α 受体拮抗药(哌唑嗪、酚妥拉明)的拮抗。(3) 与 β 受体拮抗药合用可致心动过缓的加重。(4) 利血平可使盐酸米多君的加压作用轻度增高。(5) 强心苷（洋地黄）可导

致心动过缓加重或使心脏传导紊乱或出现心律紊乱。(6) 同时使用阿托品或可的松类药可使血压增高或过度增高。

米非司酮 Mifepristone

（1）服用本品 1 周内，避免服用阿司匹林和其他非甾体抗炎药。(2) 酮康唑、伊曲康唑、红霉素和葡萄柚汁可能抑制米非司酮代谢，增加血清米非司酮水平。(3) 利福平、地塞米松、麦芽汁、苯妥英钠、苯巴比妥、卡马西平等可能诱导米非司酮代谢，降低其血清水平。(4) 可以导致作用 CYP3A4 底物的药物血清水平增加。

米力农 Milrinone

（1）与丙吡胺合用有可能导致血压过低。(2) 与硝酸酯类合用有相加效应。

米诺地尔 Minoxidil

（1）其他抗高血压药：同用可使降压作用加强。(2) 硝酸酯类：同用可使降压作用加强。(3) 非甾体抗炎药：同用使降压作用减弱。(4) 拟肾上腺素药类：同用使降压作用减弱。

米诺环素 Minocycline

四环素类抗生素可使血浆凝血酶原降低，并用时，应减少剂量。

米索前列醇 Misoprostol

（1）抗酸药会加重本品的不良反应。(2) 与非甾体解热镇痛药合用可诱发神经系统不良反应。(3) 与食物同进，可延迟本品吸收，降低不良反应发生率。

米托蒽醌 Mitoxantrone

与多柔比星合用加重心脏毒性；与抗肿瘤药合用，可能增加骨髓抑制。

莫拉司亭 Molgramostim

（1）本品不宜与抗肿瘤药联合应用，由于迅速增殖分化的造血细胞对化疗药敏感，有可能影响本品的疗效。(2) 本品可引起血浆蛋白降低，与具有血浆蛋白结合能力高的药物合用时，宜注意调整后者的用量。

莫雷西嗪 Moricizine

（1）西咪替丁：可使本品血浆药物浓度增加，同时应用时本品应减少剂量。(2) 茶碱类药物：本品可使茶碱类药物清除增加，半衰期缩短。(3) 华法林：其与华法林共用时可改变后者对凝血酶原时间的作用，在华法林稳定抗凝的患者开始用本品或停用本品时应进行监测。

莫沙必利 Mosapride

与抗胆碱药合用可能减弱本品的作用，慎与 CYP3A4 抑制药合用。

那格列奈 Nateglinide

（1）合用下列药物可能导致低血糖发生：磺吡酮、非甾体抗炎药、水杨酸盐、单胺氧化酶抑制药、非选择性 β 受体拮抗药。(2) 合用下列药物可能升高血糖水平：噻嗪类、可的松、甲状腺制剂和拟交感神经药。

那屈肝素 Nadroparin

不推荐与以下药物合用：用于解热镇痛剂量的阿司匹林、非甾体抗炎药、噻氯匹定、右旋糖酐 -40（肠道外使用）、糖皮质激素；与小剂量阿司匹林合用时有潜在出血危险，常规临床监测。

奈达铂 Nedaplatin

(1) 与其他抗肿瘤药（烷化剂、抗代谢药、抗肿瘤抗生素等）及放疗并用时，对骨髓抑制作用可能增强。(2) 与氨基糖苷类抗生素及万古霉素合用时，对肾功能和听觉器官的损害可能增加。

纳洛酮 Naloxone

美索比妥可阻断纳洛酮诱发阿片成瘾者出现的急性戒断症状。

萘丁美酮 Nabumetone

（1）本品与乙酰类抗惊厥药及磺酰脲类降糖药并用时应适当减少剂量。(2) 本品与呋塞米和血管紧张素转换酶抑制药有潜在的相互作用。

萘哌地尔 Naftopidil

本品与利尿药和降压药合用后具有协同作用，必须合用时应减量。

尼卡地平 Nicardipine

(1) 西咪替丁可抑制本品的代谢，作用增强。(2) 利福平：增强本品代谢，作用减弱。(3) 环孢素：本品可增加环孢素的血浆浓度。(4) 其他抗高血压药：可能使本品降压作用增强。(5) 地高辛：本品可增加地高辛的血浆药物浓度。

尼可刹米 Nikethamide

与其他中枢兴奋药合用，有协同作用，可引起惊厥。

尼麦角林 Nicergoline

(1) 尼麦角林可能会增强降血压药的作用。(2)尼麦角林是通过 CYP2D6 代谢，故 CYP2D6 的诱导剂或抑制药可影响本品血浆浓度。

尼美舒利 Nimesulide

本品可与血浆蛋白高度结合，可能置换其他与蛋白质结合的药物，增加后者的血浆游离浓度。

尼莫地平 Nimodipine

(1) 与氟西汀合用使其血浆浓度明显减少，而尼莫地平血浆浓度明显增加。(2) 与其他钙通道阻滞药合用增强作用。(3) 避免与 β 受体拮抗药以及肾毒性药物合用。(4) 避免与西柚汁合用。(5) 与齐多夫定合用清除率减低。(6) 利福平、巴比妥类、卡马西平、酮康唑、伊曲康唑、苯妥英钠、扑米酮可影响本品的代谢，血浆浓度或升高或降低。(7) 西咪替丁能增加尼莫地平的血浆药物浓度，使作用增强。

尼莫司汀 Nimustine

其他抗肿瘤药、放射线照射会增强骨髓抑制作用，合用时应充分观察患者状态，发现异常应减量或停药等。

尼群地平 Nitrendipine

(1) 肾上腺素 β 受体拮抗药：个别患者可能诱发和加重低血压、心力衰竭和心绞痛。(2) 其他抗高血压药合用，使降压作用增强。(3) 西咪替丁抑制本品代谢，可能使本品作用增强。(4) 本品可能增加地高辛的血浆药物浓度。

尿激酶 Urokinase

(1) 影响血小板功能的药物，如阿司匹林、吲哚美辛等不宜合用。(2) 肝素和口服抗凝药不宜与大剂量本品合用。

欧车前亲水胶
Psyllium Hydrophilic Mucilloid

可降低华法林、水杨酸盐、保钾利尿药等的作用。

帕罗西汀 Paroxetine

(1) 与 CYP 抑制药（主要是 CYP 2D6）合用可增加本品的血浓度。(2) 与 CYP 诱导剂合用可降低本品的血浓度。(3) 本品可抑制 CYP2D6，故可影响经该酶代谢药物的血浓度。(4) 与增强 5-HT 能神经功能的药物合用可引起 5-HT 综合征。(5) 能增强口服抗凝药（如华法林）和强心苷（如地高辛）的药效。

帕瑞昔布 Parecoxib

(1) 与华法林或其他抗凝药合用可增加出血风险。(2) 和低剂量阿司匹林合用将增加消化道溃疡或其他消化道并发症的风险。(3) 可减弱利尿药以及抗高血压药的作用。(4) 与 ACE 抑制药或利尿药合用时，增加发生急性肾功能不全的风险。(5) 与环孢素或他克莫司合用可以增强肾毒性。(6) 与阿片类止痛药合用时，后者只需较小剂量（常规剂量的 28% ~ 36%）就能达到相同的临床止痛效果。(7) 与氟康唑（主要是 CYP2C9 抑制药）合用，应降低本品剂量。与酮康唑（主要是 CYP3A4 抑制药）合用时，无需调整本品剂量。与主要经 CYP2D6 代谢并治疗剂量窗狭窄的药物（如氟卡尼、普罗帕酮及美托洛尔）合用时应密切监测。(8) 正在

接受锂盐治疗的患者，在开始使用本品或调整剂量时，应严密监测其血清锂浓度。

哌泊塞嗪 Pipotiazine

（1）与三环类抗抑郁药合用时，两者代谢均受到影响，血浆药物浓度均升高，导致两者毒性增加，抗胆碱作用增强。（2）与锂盐合用可导致虚弱、运动障碍、锥体外系反应加重等。（3）与哌替啶合用，可加强对中枢神经系统和呼吸的抑制。（4）与颠茄药物合用，抗胆碱作用增强。（5）可对抗左旋多巴的作用。（6）与乙醇合用可导致中枢过度抑制，用药期间禁止饮酒。

哌甲酯 Methylphenidate

与单胺氧化酶抑制药合用有产生高血压危象的风险；与升压药合用也要谨慎。

哌库溴铵 Pipecuronium Bromide

（1）加强和（或）延长作用：吸人麻醉药（氟烷、甲氧氟烷、乙醚、异氟烷、环丙烷）、静脉麻醉药（氯胺酮、芬太尼、丙泮尼地、巴比妥酸盐、嘧羟酯）、大剂量的局麻药、其他非去极化肌肉松弛药、预先给予琥珀酰胆碱、某些抗生素（氨基糖苷类和多肽类抗生素、咪唑类、甲硝唑等）、利尿药、β 受体拮抗药、维生素 B_1、单胺氧化酶抑制药、胍类、鱼精蛋白、α 受体拮抗药、钙通道阻滞药、镁盐、大多数抗心律失常药。（2）减弱作用：术前长期使用皮质激素、新斯的明、依酚氯铵、溴吡斯的明、去甲肾上腺素、茶碱、术前给予氯化钾、氯化钠、氯化钙。（3）去极化肌松药减弱非去极化肌松药的作用。（4）不确定的反应：应用本品后在给予去极化肌松药可以引起神经肌肉阻断作用的增强和减弱。

哌拉西林 Piperacillin

（1）与庆大霉素和阿米卡星或头孢菌素类抗生素合用有协同作用。（2）非甾体抗炎药：可致低凝血酶原症、血小板减少症，胃肠道溃疡等，增加凝血机制障碍或导致出血。不宜与阿司匹林、二氟尼柳合用。（3）不宜与磺吡酮合用，以免增加出血的危险性。

哌拉西林钠-他唑巴坦 Piperacillin Sodium and Tazobatam

（1）与丙磺舒合用，可降低哌拉西林和他唑巴坦的肾清除率而使血浆半衰期延长，但两药的血浆浓度不受影响。（2）与妥布霉素合用可使本品药效失活，使后者的 AUC、肾清除率及尿药浓度分别减少 11%、32% 和 38%。（3）与肌松药同用，可延长神经肌肉的阻滞作用。（4）与大剂量肝素、口服抗凝药以及抗血小板药合用，应经常检查各项凝血指标。

哌仑西平 Pirenzepine Hydrochloride

（1）H_2 受体拮抗药可增强本品的作用，两者联用时会更明显地减少胃酸分泌。（2）本品与普鲁卡因胺的作用相加，联用时可对房室结传导产生相加的抗迷走神经作用，应监测心率和心电图。（3）本品与西沙必利药效学相互拮抗，联用时可使后者的疗效明显下降。

哌嗪 Piperazine

（1）与抗寄生虫药硫氯酚或左旋咪唑有协同作用；与恩波吡维铵合用有助于治疗蛔、蛲虫混合感染。与噻嘧啶合用有拮抗作用。（2）与吩噻嗪类药物合用时毒性较各自单用时高。（3）与氯丙嗪合用可能引起抽搐，应避免使用。

哌替啶 Pethidine

本品与芬太尼因化学结构相似而有交叉过敏。本品能使双香豆素、茚满二酮等抗凝药物增效，并用时后者应按凝血酶原时间酌减用量。

哌唑嗪 Prazosin

（1）噻嗪类利尿药、β 受体拮抗药：合用使降压作用加强而水钠潴留可能减轻，应调节剂量以求每一种药物的最小有效剂量。（2）非甾体抗炎药、拟交感类药物：可使本品的降压作用减弱。（3）5-型磷酸二酯酶抑制药：可引起血压过度降低，应避免同时使用。

泮库溴铵 Pancuronium Bromide

(1)可增加泮库溴铵非去极化神经肌肉阻断作用效果的药物有吸入麻醉药（如氟烷、乙醚、安氟醚、异氟醚）、硫喷妥钠、氯胺酮、芬太尼、甲苄咪唑等，尤以安氟醚和异氟醚作用更为强大。其他非去极化神经肌肉松弛药，如琥珀酰胆碱、氨基苷类、多肽类抗生素、利尿药、肾上腺素阻断药、维生素 B_1、单胺氧化酶抑制药、奎尼丁、鱼精蛋白、苯妥英钠、咪达唑仑、甲硝唑、镁盐等都能增强其作用，应予充分注意。(2)可降低泮库溴铵非去极化神经肌肉阻断作用效果的药物有新斯的明、依酚氯铵、吡啶斯的明、去甲肾上腺素、硫唑嘌呤、茶碱、氯化钾、氯化钙。

泮托拉唑 Pantoprazole

影响抗真菌药吸收。

泼尼松 Prednisone

(1) 非甾体抗炎药可加强其致溃疡作用。(2) 可增强对乙酰氨基酚的肝毒性。(3) 与两性霉素 B 或碳酸酐酶抑制药合用，可加重低钾血症。(4) 长期与碳酸酐酶抑制药合用，易发生低血钙和骨质疏松。(5) 与蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。(6) 与抗胆碱能药（如阿托品）长期合用，可致眼压增高。(7) 三环类抗抑郁药可使其引起的精神症状加重。(8) 可使口服降糖药或胰岛素、口服抗凝药的作用减弱。(9) 甲状腺激素可使其代谢清除率增加，应适当调整后者的剂量。(10) 与避孕药或雌激素制剂合用，可加强其治疗作用和不良反应。(11) 与强心苷合用，可增加洋地黄毒性及心律失常的发生。(12) 与排钾利尿药合用，可致严重低血钾，并由于水钠潴留而减弱利尿药的排钠利尿效应。(13) 与麻黄碱合用，可增强其代谢清除。(14) 与免疫抑制药合用，可增加感染的危险性，并可能诱发淋巴瘤或其他淋巴细胞增生性疾病。(15) 可增加异烟肼在肝脏代谢和排泄，降低异烟肼的血浆药物浓度和疗效。(16) 可促进美西律在体内代谢，降低血浆药物浓度。(17) 与水杨酸盐合用，可减少血浆水杨酸盐的浓度。(18) 与生长激素合用，可抑制后者的促生长作用。(19) 苯巴比妥、苯妥英钠、利福平可使本品作用减弱。

泼尼松龙 Prednisolone

（见曲安奈德）

葡萄糖酸钙 Calcium Gluconate

与噻嗪类利尿药同用，可增加肾脏对钙的重吸收而致高钙血症。

葡萄糖酸锌 Zinc Gluconate

(1) 勿与面包、纤维素和植物酸多的食物（芹菜、菠菜）及牛奶同服。勿与铝盐、钙盐、碳酸盐、鞣酸等同用。(2) 本品可降低青霉胺、四环素类药品的作用。

普鲁卡因 Procaine

(1) 可加强肌松药的作用，使肌松药作用时间延长，与肌松药合用宜减少肌松药的用量。(2) 与其他局部麻醉药合用时应减量。(3) 本品可削减磺胺药的药效，不宜同时应用磺胺药。(4) 本品可增强洋地黄类药物的作用，合用可导致其毒性反应。(5) 新斯的明等抗胆碱酯酶药物可干扰本品代谢，使本品毒性增强，忌联合应用。(6) 本品可加深麻醉性镇痛药对呼吸的抑制及致低血压的作用。

普鲁卡因胺 Procainamide

(1) 其他抗心律失常药物、抗毒蕈碱药物：合用时效应相加。(2) 胺碘酮：改变静脉普鲁卡因的药动学特性，降低其清除率，延长其半衰期。(3) 抗高血压药：合用降压作用可增强。(4) 拟胆碱药：合用时本品可抑制这类药对横纹肌的效应。(5) 神经肌肉阻滞药：合用时神经肌肉接头的阻滞作用增强，时效延长。(6) 乙醇：缩短本品半衰期。(7) 抗酸药：降低其生物利用度。(8) 西咪替丁：降低普鲁卡因胺和乙酰卡尼的肾清除率。(9) 雷尼替丁：影响本品在肾脏的代谢。(10) 甲氧苄啶：降低普鲁卡因胺的肾清除率。

普罗布考 Probucol

(1) 香豆素类：本品能加强香豆素类药物的抗凝血作用。(2) 降糖药：本品能加强降糖药的作用。(3) 环孢素：本品可明显降低环孢素的血浆药物浓度。

普罗帕酮 Propafenone

(1) 奎尼丁：减慢本品代谢。(2) 局麻药：增加中枢神经系统不良反应的发生。(3) 地高辛：增加地高辛血清浓度。(4) 普萘洛尔、美托洛尔：普罗帕酮显著增加两者血浆浓度和清除半衰期。(5) 华法林：增加华法林的血浆药物浓度和凝血酶原时间。(6) 苯巴比妥或利福平：减少普罗帕酮的血浆药物浓度。

普萘洛尔 Propranolol

(1) 钙通道阻滞药，特别是静脉注射维拉帕米，要十分警惕本品对心肌和传导系统的抑制。(2) 洋地黄类：发生房室传导阻滞而致心率过慢。(3) 肾上腺素、去氧肾上腺素或拟交感胺类：引起显著高血压、心率过慢，也可能出现房室传导阻滞。(4) 异丙肾上腺素和黄嘌呤：可使后者疗效减弱。(5) 乙醇：减弱本品吸收速率。(6) 苯妥英钠、苯巴比妥和利福平：加速本品清除。(7) 氢氧化铝凝胶合用：降低普萘洛尔的肠吸收。(8) 氟哌啶醇：导致低血压及心脏停搏。(9) 抗高血压药物：与利血平同用，可导致头晕、晕厥心动过缓及直立性低血压。与单胺氧化酶抑制药同用，可致极度低血压。(10) 氯丙嗪：可增加两者的血浆药物浓度。西咪替丁：增加普萘洛尔的浓度。(11) 茶碱类和利多卡因：降低本品的清除率。(12) 甲状腺素：导致 T_3 浓度降低。(13) 降糖药：本品可影响血糖水平，与降糖药同用时，需调整降糖药的剂量。

七氟烷 Sevoflurane

CYP2E1 诱导药（异烟肼、乙醇）可增加本品代谢。

齐多夫定 Zidovudine

(1) 本品使肾毒性药物与骨髓抑制药物的毒性增强。(2) 齐多夫定与非甾体抗炎药合用增加血液学毒性。(3) 美沙酮可能使齐多夫定的血浆药物浓度升高。(4) 克拉霉素片剂减少齐多夫定的吸收。(5) 齐多夫定避免与利福霉素合用。(6) 齐多夫定使苯妥英钠的血浆药物浓度升高或降低；丙戊酸盐可能使齐多夫定的血浆药物浓度升高（增加毒性发生的危险性）。(7) 氟康唑使齐多夫定的血药浓度升高。(8) 齐多夫定与乙胺嘧啶合用叶酸拮抗作用增强。(9) 齐多夫定与更昔洛韦合用会发生深度骨髓抑制；利巴韦林可能抑制齐多夫定的作用；齐多夫定可能抑制司他夫定的作用；替拉那韦可使齐多夫定的血药浓度降低。(10) 丙磺舒抑制齐多夫定的消除。

齐拉西酮 Ziprasidone

(1) 可延长心电图 QT 间期的药物与本品合用，可加剧心律失常、心脏停搏的风险，不宜合用。(2) 与其他作用于中枢的药物合用时应谨慎。(3) 可能会增强某些抗高血压药的疗效。(4) 本品可拮抗左旋多巴和多巴胺的激动作用。

前列地尔 Alprostadil

本品可增强降压药和血小板聚集抑制药的作用。

羟丁酸钠 Sodium Hydroxybutyrate

(1) 与阿托品合用可减少本品对副交感神经兴奋作用，防止心率减慢发生。(2) 与肌松药合用时，可增强肌松作用。(3) 与巴比妥类及催眠类药合用时可减少锥体外系症状。

羟基脲 Hydroxycarbamide

(1) 本品可能减少氟尿嘧啶转变为活性代谢物（Fd-UMP），两者并用应慎重。(2) 本品对中枢神经系统有抑制作用，慎与巴比妥类、地西泮类、麻醉药等同用。(3) 本品有可能提高患者血中尿酸的浓度，故与别嘌醇、秋水仙碱、丙磺舒等合用时须调整上述药物剂量。

羟考酮 Oxycodone

(1)避免同时使用单胺氧化酶抑制药。(2)镇静药、麻醉药、催眠药、乙醇、抗精神病药、肌肉松弛药、抗抑郁药、吩噻嗪类和抗高血压药合用，可加强对中枢神经的抑制作用。(3)CYP3A抑制药：西咪替丁，酮康唑和红霉素等作用可能抑制羟考酮的代谢。

羟氯喹 Hydroxychloroquine

(1)与氯丙嗪等合用，易加重肝脏负担。(2)本品对神经－肌肉接头有直接抑制作用，链霉素可加重此不良反应。(3)洋地黄化后应用本品易引起心脏传导阻滞。(4)与肝素或青霉胺合用，可增加出血机会。(5)与氯化铵合用，可加速本品排泄而降低血浆药物浓度。(6)与单胺氧化酶抑制药合用可增加毒性。(7)与氯喹同类物（阿莫地喹、羟氯喹等）同用时，可使氯喹血浆药物浓度提高。(8)抑酸药能够减少氯喹和羟氯喹的吸收。(9)氯喹和羟氯喹与胺碘酮合用能增加室性心律失常。(10)氯喹和羟氯喹与莫西沙星合用能增加室性心律失常。(11)氯喹和羟氯喹与抗癫痫药合用可能增加惊厥的发生。(12)蒿甲醚／本芴醇避免与氯喹和羟氯喹合用。(13)氯喹和羟氯喹与甲氟喹合用能增加惊厥发生。(14)氯喹和羟氯喹可能增高地高辛的血药浓度。(15)氯喹和羟氯喹能够增高环孢素的血药浓度。(16)氯喹和羟氯喹可能增加重症肌无力的症状，减弱新斯的明和吡斯的明作用。(17)西咪替丁能够抑制氯喹和羟氯喹的代谢。

羟乙膦酸钠 Etidronate Disodinm

(1)抗酸药和导泻药因常含有钙或其他二价金属离子，而影响其吸收。(2)与氨基糖苷类合用会诱发低钙血症。

青蒿素 Artemisinin

(1)与伯氨喹合用可根治间日疟。(2)与甲氧苄啶合用有增效作用，并可减少疟疾近期复燃或复发。

青霉胺 Penicillamine

(1)吡唑类药物可增加本品血液系统不良反应的发生率。(2)本品可加重抗疟药、金制剂、免疫抑制药等对血液系统和肾毒性。(3)与铁剂同服，可使本品的吸收减少2/3。(4)含有氢氧化铝或氢氧化镁的抗酸药可减少本品的吸收，如本品必须与抗酸药合用时，两药服用时间最好间隔2小时。(5)本品可拮抗维生素B_6的作用，长期服用本品者，维生素B_6需要量增加，可一日加服25 mg维生素B_6。(6)与地高辛合用时，可明显降低地高辛的血浆药物浓度。

青霉素 Benzylpenicillin

(1)与丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、磺胺类药同用，可减少本品排泄，毒性有可能增加。(2)与华法林同用，可加强其抗凝血作用。(3)与甲氨蝶呤同用，可增加甲氨蝶呤毒性。(4)与四环素类、红霉素、氯霉素、磺胺类等抑菌药同用，可能使本品抗菌作用降低。(5)与考来烯胺同用，可降低本品的吸收。(6)与考来替泊同用，可使本品血浆药物浓度降低。(7)与避孕药同用，可降低避孕药的药效。

氢化可的松 Hydrocortisone

(1)与拟胆碱药（新斯的明、吡斯的明）合用，可增强后者的疗效。(2)与维生素E或维生素K合用，可增强本品的抗炎效应，减轻撤药后的反跳现象；与维生素C合用可防治本类药物引起的皮下出血反应；与维生素A合用可消除本类药物所致创面愈合迟延，但也影响本类药物的抗炎作用，本类药物还可拮抗维生素A中毒时的全身反应（恶心、呕吐、嗜睡等）。(3)本品有可能使氨茶碱血浆药物浓度升高。(4)与非甾体类抗炎药合用，可增加本品的抗炎作用，但亦加剧致溃疡作用。本品可降低血浆水杨酸盐的浓度，可增强对乙酰氨基酚的肝毒性。(5)避孕药或雌激素制剂可加强本品的治疗作用和不良反应。(6)与强心苷合用可提高强心效应，但也增加洋地黄毒性及心律失常的发生，故两者合用时应适当补钾。(7)与

蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。(8) 与两性霉素B和碳酸酐酶抑制药等排钾利尿药合用时可致严重低血钾，应注意血钾和心功能变化。长期与碳酸酐酶抑制药合用，易发生低血钙和骨质疏松；噻嗪类利尿药可消除本类药物所致的水肿。(9) 与降糖药（如胰岛素）合用时，因可使糖尿病患者血糖升高，应适当调整降糖药剂量。(10) 与抗胆碱能药（阿托品）长期合用，可致眼压增高。(11) 三环类抗抑郁药可使本品引起的精神症状加重。(12) 可增强异丙肾上腺素的心脏毒性作用。(13) 与单胺氧化酶抑制药合用时，可能诱发高血压危象。(14) 与免疫抑制药合用，可增加感染的危险性。(15) 苯妥英钠和苯巴比妥可加速本类药物的代谢，降低药效。(16) 本类药可抑制生长激素的促生长作用。(17) 糖皮质激素可降低奎宁的抗疟疾效果。(18) 本品及其他糖皮质激素可降低抗凝药、神经肌肉阻滞药的药理作用。(19) 甲状腺激素、麻黄碱、利福平等药可增加本品的代谢清除率，合用时应适当调整本品剂量。(20) 本类药可促进异烟肼、美西律代谢，降低后者血浆药物浓度和疗效。(21) 考来烯胺、考来替泊等可减少本类药的吸收。

氢醌 Hydroquinone

与过氧化氢或过氧苯甲酰同用可能导致皮肤黑染，如发生上述情况，立即停止使用并用肥皂和清水洗净皮肤，皮肤黑染可以消除；避免与含间苯二酚、酚、水杨酸等药物同时外用。

氢氯噻嗪 Hydrochlorothiazide

(1) 糖皮质激素、雌激素、两性霉素B（静脉用药），能降低本品的利尿作用，增加发生电解质紊乱的机会，尤其是低钾血症。(2) 非甾体抗炎药：尤其是吲哚美辛，降低本品的利尿作用。(3) 拟交感胺类药物：利尿作用减弱。(4) 考来烯胺：可减少胃肠道对本品的吸收。(5) 多巴胺：利尿作用加强。(6) 其他抗高血压药：降压作用加强。(7) 抗痛风药：本品可使尿酸排泄减少，血尿酸水平升高，合用时抗痛风药应调整剂量。(8) 抗凝药：使抗凝药作用减弱。(9) 降糖药：降低降糖药的作用。(10) 锂盐：因本品可减少肾脏对锂的清除，可增加锂的肾毒性。

氢溴酸山莨菪碱

Anisodamine Hydrobromide

(1) 本品可增加维生素B_2吸收。(2) 本品可提高中药洋金花麻醉效果，减少其剂量和不良反应。(3) 与哌替啶合用可增强抗胆碱作用。(4) 本品可抵消西沙比利对胃肠道的动力作用。(5) 与其他抗胆碱药合用可能引起抗胆碱作用相加，增加不良反应。(6) 抗心绞痛药：影响硝酸甘油、戊四硝酯、硝酸异山梨酯舌下用药的吸收。(7) 本品可拮抗去甲肾上腺素所致的血管痉挛。(8) 本品可拮抗毛果芸香碱的促分泌作用。(9) 本品可减少抗结核药的肝损害。

氢氧化铝 Aluminium Hydroxide

(1) 四环素类抗菌药影响其吸收。(2) 干扰其他药物的吸收、消除及疗效，如地高辛等。(3) 影响脂溶性维生素吸收。(4) 加快肠溶药溶解。

秋水仙碱 Colchicine

(1) 秋水仙碱与克拉霉素或红霉素合用能增加毒性发生的危险性。(2) 与环孢素合用可能增加肾毒性和肌肉毒性发生的危险性（环孢素的血浆药物浓度增高）。

巯嘌呤 Mercaptopurine

(1) 与别嘌醇合用作用增强，毒性增大，合用时应将巯嘌呤的剂量减为原来的1/4。(2) 巯嘌呤与氨基水杨酸盐合用可能增加白血病发生的危险。(3) 当巯嘌呤与磺胺甲噁唑合用时增加血液系统毒性发生的危险。(4) 巯嘌呤可能减弱香豆素类的抗凝作用。(5) 本品与肝毒性药物同用，肝毒性增加。(6) 本品其他抗肿瘤药或放疗合用，会增强本品效应，但需注意骨髓抑制的不良反应。

曲安奈德 Triamcinolone Acetonide

(1) 非甾体抗炎药可加强其致溃疡作用。(2) 本品可增强对乙酰氨基酚的肝

毒性。(3) 与两性霉素B或碳酸酐酶抑制药合用，可加重低钾血症，长期与碳酸酐酶抑制药合用，易发生低血钙和骨质疏松。(4) 与蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。(5) 与抗胆碱能药（如阿托品）长期合用，可致眼压增高。(6) 三环类抗抑郁药可使其引起的精神症状加重。(7) 与降糖药如胰岛素合用时，因可使糖尿病患者血糖升高，应适当调整降糖药剂量。(8) 甲状腺激素可使其代谢清除率增加，故甲状腺激素或抗甲状腺药与其合用，应适当调整后者的剂量。(9) 与避孕药或雌激素制剂合用，可加强其治疗作用和不良反应。(10) 与强心苷合用，可增加洋地黄毒性及心律失常的发生。(11) 与排钾利尿药合用，可致严重低血钾，并由于水钠潴留而减弱利尿药的排钠利尿效应。(12) 与麻黄碱合用，可增强其代谢清除。(13)与免疫抑制药合用，可增加感染的危险性，并可能诱发淋巴瘤或其他淋巴细胞增生性疾病。(14) 可增加异烟肼在肝脏代谢和排泄，降低异烟肼的疗效。(15) 可促进美西律在体内代谢，降低血浆药物浓度。(16)与水杨酸盐合用，可减少血浆水杨酸盐的浓度。(17) 与生长激素合用，可抑制后者的促生长作用。

曲马多 Tramadol

(1) 本品与选择性5-羟色胺再摄取抑制药（SSRI）、三环抗抑郁药（TCA）、单胺氧化酶抑制药（MAO）、抗精神病药物合用，能增加癫痫发作的危险性。(2) 与乙醇、镇静药、镇痛药或其他精神药物合用会引起急性中毒。(3) 本品与中枢神经系统抑制药（如地西泮）合用时应适当减量。(4) 同时使用或用药前使用卡马西平会导致镇痛效果及有效作用时间的缩短。(5) 不建议与曲马朵激动药／拮抗药（如丁丙诺啡、纳布啡、喷他佐辛）同时使用，因为会削弱纯激动药的镇痛作用。(6) 有报道5-羟色胺综合征的散发病例与曲马朵和选择性5-羟色胺再摄取抑制药一起使用有关。(7) 与香豆素类衍生物（如华法林）合用瘀斑会增多，应监测INR。

曲美布汀 Trimebutine

本品与普鲁卡因胺合用，可对窦房结传导产生相加性的抗迷走作用。两者合用时，应监测心率和心电图。

曲普利啶 Triprolidine

服药期间不可同用单胺氧化酶（MAO）抑制药、中枢性镇静或催眠药及含有乙醇的饮品。

曲普瑞林 Triptorelin

不能与升高泌乳素浓度的药物同时使用，因可降低垂体中的GnRH受体水平。

曲唑酮 Trazodone

(1) 与单胺氧化酶抑制药合用，可能会导致严重不良反应。(2) 可增强乙醇和中枢神经抑制药的中枢神经抑制作用。(3) 与可增强5-HT能神经功能的药物合用时可引起5-HT综合征。

去甲肾上腺素 Noradrenaline

单胺氧化酶抑制药：合用有引起高血压危象的风险。其他见肾上腺素项。

去氯羟嗪 Decloxizine

本品与乙醇和其他中枢抑制药有相加作用，不应同服。

去铁胺 Deferoxamine

(1) 维生素：用去铁胺治疗1～2周后同时加用一日200 mg维生素C促进尿铁排泄，但慢性铁负荷过重患者去铁胺与大剂量（每日500 mg以上）维生素C合用可引起心功能受损，停用维生素C后可恢复。(2) 与丙氯拉嗪合用，可引起暂时意识障碍、锥体功能失调和昏迷。

去氧氟脲苷 Oxifluridine

本品与索立夫定合用时代谢受阻，血药浓度上升，导致严重的血液毒性等不良反应。

去氧肾上腺素 Phenylephrine

(1) α受体拮抗药：先用α受体拮

附录

抗药，可减弱本品的升压作用。(2) 全麻药：尤其环丙烷或卤代碳氢化合物同用，易引起室性心律失常。(3) 抗高血压药：可使降压作用减弱。(4) 缩宫药：可引起严重的高血压。(5) 单胺氧化酶 (MAO) 抑制药：可使本品的升压作用增强，在使用 MAO 抑制药后 14 日内禁用本品。(6) 三环类抗抑郁药：本品升压作用增强。(7) 硝酸盐类：可使本品的升压作用与硝酸盐类的抗心绞痛作用均减弱。(8) 拟交感神经药：可使这类药潜在的不良反应容易显现。

炔雌醇　Ethinylestradiol

口服 1 g 维生素 C 能使单次口服炔雌醇生物利用度提高到 60% ~ 70%。与孕激素类药合用，具有抑制排卵的协同作用，可用作避孕药。

人血白蛋白　Huma Serum Albumin

本品不宜与血管收缩药，蛋白水解酶或含乙醇的注射液混合使用。

人促红细胞生成素 Human Erythropoietin

(1) 与血管紧张素转换酶抑制药合用时拮抗降压作用并增加高钾血症发生的危险性。(2) 与血管紧张素 Ⅱ 受体拮抗药合用时拮抗降压作用并增加高钾血症发生的危险性。

绒促性素　Chorionic Gonadotrophin

与脑下垂体促性腺激素合用时，可能增加不良反应。

柔红霉素　Daunorubicin

柔红霉素与有心脏毒性和作用于心脏的药物合用应监控心功能。合并使用影响肝肾功能的药物也将影响柔红霉素的毒性和（或）药效。

鞣酸蛋白　Albumine Tannate

能影响各种消化酶的药效，故不宜同服。

乳杆菌活菌　Living Preparation of Lactobacillus

本品对多种抗生素，如 β - 内酰胺类、大环内酯类、氨基糖苷类等敏感，如使用请延长间隔用药时间。

乳果糖　Lactulose

与新霉素合用可提高治疗肝性脑病的疗效；与抗酸药合用，降低本品疗效，不宜合用。

乳酶生　Lactasin

不宜与抗菌药物（红霉素、氯霉素、土霉素等）或吸着剂合用，应分开服（间隔 2 ~ 3 小时）。

乳酸钠　Soclium Lactate

乳酸钠与新生霉素钠、盐酸四环素、磺胺嘧啶钠呈配伍禁忌。

乳糖酶　Lactase

有研究表明乳糖酶会减少钙离子的吸收。

瑞芬太尼　Remifentanil

中枢神经系统抑制药物与本品也有协同作用，合用时应慎重，并酌情减量；禁与单胺氧化酶抑制药合用。

瑞格列奈　Repaglinide

(1) 合用下列药物可能导致低血糖发生：吉非贝齐、克拉霉素、酮康唑、伊曲康唑、其他类型抗糖尿病药、单胺氧化酶抑制药、非选择性 β 受体拮抗药、ACE 抑制药、非甾体抗炎药、水杨酸盐、奥曲肽、乙醇及促合成代谢的激素。(2) 合用下列药物可能升高血糖水平：口服避孕药、噻嗪类药物、皮质激素、达那唑、甲状腺激素和拟肾上腺素药。

瑞舒伐他汀　Rosuvastatin

(1) 同时服用维生素 K 拮抗药（如华法林）的患者，开始使用或逐渐增加本品剂量可能导致 INR 升高。(2) 抗酸药：合用含铝、镁的抗酸药，可使本品的血浆

浓度降低约 50%。(3) 红霉素：合用可导致本品的 AUC 及 C_{max} 下降。(4) 口服避孕药／激素替代治疗（HRT）：使炔雌醇和炔诺孕酮的 AUC 增加。(5) 吉非贝齐：会升高本品的血浆药物浓度，从而增加肌病的风险，不宜合用。(6) 环孢素：可升高本品的血药浓度，合用时应限制于一日 1 次 5 mg。

塞来昔布 Celecoxib

(1) 塞来昔布主要经 CYP2C9 代谢。与有抑制 CYP2C9 作用的药物同服时应注意。(2) 本品会减弱血管紧张素转换酶抑制药的抗高血压作用。(3) 非甾体抗炎药在一些患者中会降低呋塞米和噻嗪类利尿药的促尿钠排泄作用，其与肾脏的前列腺素合成被抑制有关。(4) 本品可与低剂量的阿司匹林合用，胃肠道的溃疡和其他并发症的发生率会增加。(5) 同时服用氟康唑 200 mg 一日 1 次，塞来昔布的血浆药物浓度升高 2 倍。这是由于塞来昔布的代谢被抑制。接受氟康唑治疗的患者应给予本品最低推荐剂量。(6) 研究表明：同时服用锂盐一次 450 mg，一日 2 次和本品 200 mg，一日 2 次的受试者中，锂盐稳态血浆浓度较单用锂盐的受试者升高约 17%。对接受锂盐治疗者在开始使用和停用本品时，须密切观察。(7) 对接受华法林或其他类似药治疗者，特别在开始服用本品的数日内或改变其剂量时，患者发生出血并发症的危险性增高，要监测患者的抗凝血活性。

塞替派 Thiotepa

(1) 塞替派可增加血尿酸水平。(2) 与氯琥珀胆碱同用可使呼吸暂停延长，在接受塞替派治疗的病人，应用氯琥珀胆碱前必须测定血中假胆碱酯酶水平。(3) 与尿激酶同用可增加塞替派治疗膀胱癌的疗效，尿激酶为纤维蛋白溶酶原的活化剂，可增加药物在肿瘤组织中的浓度。

噻氯匹定 Ticlopidine

(1) 血小板聚集抑制药、溶栓药及导致低凝血酶原血症或血小板减少的药物：合用均可加重出血的危险，避免联合使用。若临床确有必要联合用药，应密切观察并进行实验室监测。(2) 茶碱：合用时因其降低了茶碱的清除率，会使茶碱血浆药物浓度升高并有过量的危险。故用本品期间及之后应调整茶碱用量，必要时进行茶碱血浆药物浓度监测。(3) 环孢素：偶见降低环孢素血浆药物浓度的报道，故两者合用时应定期进行环孢素血浆药物浓度监测。

噻吗洛尔 Timolol

(1) 肾上腺素：合用可引起瞳孔扩大。(2) 不主张两种局部 β 受体拮抗药同时应用。(3) 钙通道阻滞药：心功能受损的患者，应避免两种药合并使用。(4) 儿茶酚胺耗竭药（如利血平）：引起低血压和明显的心动过缓。(5) 洋地黄、地尔硫䓬或维拉帕米：增加延长房室传导阻滞作用。(6) 奎尼丁：引起心率减慢等全身 β 受体拮抗的不良反应。(7) 可乐定：加重可乐定停药后的血压反弹。(8) 可能减弱有遗传性过敏史的患者的抗过敏药的作用。

噻嘧啶 Pyrantel

本品与哌嗪类药相互拮抗，不能合用。

噻托溴铵 Tiotropium Bromide

不推荐与其他抗胆碱药合用。

赛庚啶 Cyproheptadine

(1) 不宜与乙醇合用，因可增强其镇静作用。(2) 不宜与中枢神经系统抑制药合用。(3) 与吩噻嗪类药（如氯丙嗪等）合用可增加室性心律失常的危险性，严重者可致尖端扭转型心律失常。(4) 服药时避免饮用含有乙醇的饮料。

三氟拉嗪 Trifluoperazine

(1) 与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，可增强中枢抑制作用。(2) 与抗高血压药合用，易致直立性低血压。(3) 本品与舒托必利合用有增加室性心律失常危险，严重者可致尖端扭转型心律失常。(4) 本品与其他阿托品类药物合用，不良反应相加。(5) 与三环类抗抑郁药合

用时，能引起镇静过度。(6) 锂盐可加重本品的不良反应。(7) 与文拉法辛合用时发生恶性综合征的危险增加。

三尖杉碱 Harringtonine

(1) 与有骨髓抑制作用的抗癌药物或放疗合用时应调整本品的剂量与疗程。(2) 已反复使用多柔比星或柔红霉素等蒽环类抗生素的患者慎用或不用。

三尖杉酯碱 Homoharringtonine

(1) 本品与其他可能抑制骨髓功能的抗癌药物或放射疗法合并应用时应调节本品的剂量与疗程。(2) 蒽环类抗生素有心肌毒性作用，老年患者及已反复采用多柔比星或柔红霉素等蒽环类抗生素治疗的患者使用三尖杉酯碱应慎用或不用，以免增加心脏毒性。

三磷腺苷 Adenosine Triphosphate

(1) 冠状动脉扩张药：相互增强作用。(2) 双嘧达莫：可能增加本品的不良反应。(3) 阿托品：可防止发生严重的瞬间心律失常。(4) 强心苷：可减轻强心苷的毒性反应，降低心律失常的发生率。(5) 茶碱、咖啡因：可对抗腺苷作用，从而降低本品疗效。

沙丁胺醇 Salbutamol

(1) 本品与其他 β 受体激动药合用，药效可增加，但不良反应也会增加。(2) 与 β 受体拮抗药合用，本品药效减弱或消失。(3) 本品不宜与抗抑郁药合用。(4) 本品与茶碱类药合用时，可增加松弛支气管平滑肌的作用，但也可能增加不良反应。

沙格雷酯 Sarpogrelate

与抗凝血药（如华法林等）或抗血小板药合用，可引起出血或延长出血时间。

沙利度胺 Thalidomide

与地塞米松合用，发生中毒性表皮坏死松解症的危险性增加。

沙美特罗 Salmeterol

（见其他 $β_2$ 受体激动药）

舍曲林 Sertraline

(1) 与乙醇合用，可使精神和运动技能损害的危险性增加。(2) 与血浆蛋白结合率高的药物合用时，可能存在潜在的药物相互作用。(3) 本品能抑制 CYP2D6，慎与 CYP2D6 代谢的药物合用。(4) 与锂盐合用时可能产生药效学的药物，出现震颤，应谨慎。(5) 与其他能增强 5-HT 神经功能的药物（如氯米帕明、阿米替林、丙米嗪、苯丙胺）合用，可导致 5-HT 综合征。(6) 与茶碱合用，使后者的血浓度升高，增加茶碱的不良反应发生。(7) 本品能抑制苯妥英钠的代谢，使后者的毒性增加。(8) 肝酶 CYP 诱导剂（如利福平）可加速本品代谢，使疗效降低。(9) 与华法林合用可延长凝血酶原时间。

肾上腺素 Adrenaline

(1) α 受体拮抗药以及各种血管扩张药：可对抗本品的加压作用。(2) 全麻药：易产生心律失常，直至心室颤动。用于指、趾部局麻时，药液中不宜加用本品，以免肢端供血不足而坏死。(3) 洋地黄、三环类抗抑郁药：可致心律失常。(4) 麦角制剂：可致严重高血压和组织缺血。(5) 利血平、胍乙啶：可致高血压和心动过速。(6) 肾上腺素 β 受体拮抗药：两者的 β 受体效应互相抵消，可出现血压异常升高、心动过缓和支气管收缩。(7) 其他拟肾上腺素药物：心血管作用加剧，易出现不良反应。(8) 硝酸酯类：本品的升压作用被抵消，硝酸酯类的抗心绞痛作用减弱。(9) 降糖药：可使降糖效应减弱。

生长抑素 Somatostatin

(1) 本品可延长美索比妥引起的睡眠时间，加剧戊烯四唑的药理作用，不宜与这类药物或产生同样作用的药物同时使用。(2) 由于本品对阿片类镇痛药活性的拮抗，可能使吗啡的镇痛作用减弱。

十一酸睾酮

Testosterone Undecanoate

为提高疗效，可同时服用适量蛋白质、糖和维生素等。

舒巴坦 Sulbactan

与氨苄西林联合应用，可使后者的最小抑菌浓度降低而增效，对产酶的菌株恢复敏感。

舒必利 Sulpiride

（1）与曲马多、佐替平合用，可增加癫痫发作的风险。（2）与三环类抗抑郁药合用可导致嗜睡。（3）锂盐可加重本品的不良反应并降低药效。（4）抗酸药和止泻药可降低本品吸收率，使用时两者之间至少间隔1小时。

舒芬太尼 Sufentanil

（1）同时给予高剂量的本品和高浓度的氧化亚氮时可导致血压、心率降低以及心排血量的减少。（2）一般建议麻醉或外科手术前2周，不应该使用单氨氧化酶抑制药。（3）本品与肝酶CYP3A4抑制药，如红霉素、酮康唑、伊曲康唑和利托那韦合用，使本品代谢从而延长呼吸抑制作用。如必须与上述药物同时应用，应该对患者进行特殊监测，并且应降低本品的剂量。

舒林酸 Sulindac

(1)与抗凝血药华法林同时服用时可致凝血酶原时间延长。(2)与降糖药（甲苯磺丁脲等）同服可使空腹血糖下降明显。(3)与阿司匹林同服可降低本品活性，使本品的疗效反而降低，且可能出现周围神经病变。

舒马普坦 Sumatriptan

（1）与其他曲坦类$5\text{-}HT_1$激动药同用，增加血管痉挛的危险性。使用本品24小时内不宜使用其他$5\text{-}HT_1$激动药。（2）与麦角碱类药物（双氢麦角胺、麦角胺、美西麦角、甲麦角新碱、麦角新碱）合用可引起血管痉挛效应延长。使用本品后需隔6小时才可用含麦角碱制剂，使用麦角碱制剂后需隔24小时才可用本品。（3）禁与MAO-A抑制药合用。（4）与5-HT再摄取抑制药合用，药理作用累加，有引起5-HT综合征的危险。

舒尼替尼 Sunitinib

（1）CYP3A4诱导药，如利福平等可降低本品的血药浓度。（2）CYP3A4强抑制药，如酮康唑等可增加本品的血药浓度。

双八面体蒙脱石

Dioctahedral Smectite

（1）本品与诺氟沙星合用可提高对致病性细菌感染的疗效。（2）本品可减轻红霉素的胃肠反应，提高红霉素的疗效。

双氯芬酸 Diclofenac acid

（1）丙磺舒可使本品排泄减少、血药浓度升高、毒性增加，故合用时宜减少本品剂量。（2）与维拉帕米或硝苯地平合用时，本品的血药浓度升高。（3）本品可使地高辛的血药浓度升高。若两者合用，应调整地高辛的用量并监测其血药浓度，以避免药物中毒。

双氯芬酸钠 Diclofenac Sodium

（1）丙磺舒可使本品排泄减少，毒性增加。（2）与维拉帕米或硝苯地平合用，本品血药浓度升高。（3）可使地高辛的血浆药物浓度升高。（4）可增强抗糖尿病药（包括口服降糖药）的作用，降低胰岛素的作用。（5）使甲氨蝶呤排泄减少、血浆药物浓度升高。（6）可抑制苯妥英钠的降解。（7）与保钾利尿药合用时可引起高钾血症。可减弱呋塞米的排钠和降压作用。（8）与阿司匹林同用时，胃肠道不良反应及出血倾向增加。与对乙酰氨基酚长期合用，增加肾脏不良反应。（9）与抗凝药（如肝素、双香豆素）、抗血小板药、己酮可可碱合用，可增加出血的危险。（10）与氨苯蝶啶合用可致急性肾衰竭。

双嘧达莫 Dipyridamole

（1）与阿司匹林有协同作用。（2）与双香豆素抗凝药同用时并不增加出血。（3）与肝素、溶栓药、吲哚美辛、头孢孟

多、头孢替坦、头孢哌酮、丙戊酸钠等合用时，可进一步抑制血小板聚集，增加出血危险。

双歧杆菌活菌制剂
Live Bifidobacterium Preparation

(1) 抗生素与本品合用时可减弱后者的疗效，应分开服用。(2) 铋剂、鞣酸、药用炭、酊剂等能抑制、吸附或杀灭活菌，故不能合用。

双歧三联活菌制剂 Bifid Triple Viable

本品不宜与抗菌药物同用。

双氢可待因 Dihydrocodeine

(1) 与中枢神经抑制药（如吩噻嗪类药、巴比妥类药等）、三环类抗抑郁药、吸入性麻醉药、MAO 抑制药、β 受体阻滞药（如普萘洛尔）、乙醇等有协同作用，会增强中枢抑制作用。(2) 与香豆素类抗凝药合用，会增强抗凝血作用。(3) 与抗胆碱能药合用，会增强抗胆碱作用。

双氢麦角胺
Dihydroergotamine Mesylate

(1) 与可卡因、肾上腺素、去甲肾上腺素、利多卡因、氯雷他定、米多君、伪麻黄碱、利托那韦等合用，可因协同作用而致血压骤升。(2) 与佐米曲坦、琥珀酸舒马坦、利扎曲坦及那拉曲坦合用，可因协同作用而致血管痉挛反应延长。(3) 与右苯丙胺、西布曲明合用，可致 5-HT 综合征，表现为意识障碍、精神状态改变、出汗、震颤、肌阵挛、寒战、反射亢进及高血压，可能的机制为增加了突触的血清素水平而使血清素受体受到过度刺激。(4) 安普那韦、那非那韦、沙奎那韦、英地那韦、硝酸甘油、地拉非定、克拉霉素、地红霉素、依法维仑、红霉素等，可减少本品代谢，导致麦角中毒的危险。

顺阿曲库铵 Cisatracurium

(1) 增强疗效的药物：麻醉药（如恩氟烷、异氟烷和氟烷、氯胺酮），其他非去极化神经肌肉阻滞药、抗生素（包括氨基糖苷类、多黏菌素、大观霉素、四环素、林可霉素和克林霉素）、抗心律失常药物（包括普萘洛尔、钙通道阻滞药、利多卡因、普鲁卡因胺和奎尼丁）、利尿药（包括呋塞米噻嗪类、甘露醇和乙酰唑胺）、镁盐、锂盐、神经节阻滞药等。(2) 降低疗效的药物：苯妥英钠、卡马西平。(3) 合用琥珀酰胆碱来延长非去极化神经肌肉阻滞药的效应可能导致延长的复合性阻滞作用而难以用抗胆碱酯酶药逆转。

顺铂 Cisplatin

(1) 与秋水仙碱、丙磺舒或磺吡酮合用时，由于顺铂可能提高血液中尿酸的水平，必须调节其剂量，以控制高尿酸血症与痛风。(2) 抗组胺药、酚噻嗪类药或噻吨类药与顺铂合用，可能掩盖耳毒性的症状，如耳鸣、眩晕等。(3) 顺铂诱发的肾功能损害可导致博来霉素（甚至小剂量）的毒性增加。与各种骨髓抑制药或放射治疗同用，可增加毒性作用，用量应减少。(4) 青霉胺或其他螯合剂，可减弱顺铂的活性。(5) 与异环磷酰胺合用，会加重蛋白尿，同时增加耳毒性。(6) 顺铂化疗期间，与如头孢菌素或氨基糖苷类以及利尿药合并使用可诱发肾功能损伤。(7) 病人接受顺铂化疗后至少 3 个月，才可接受病毒疫苗接种。

丝裂霉素 Mitomycin

(1) 与其他抗恶性肿瘤药物或放疗合用，会增强骨髓抑制等不良反应。(2) 与长春碱类药物如硫酸长春新碱、硫酸长春碱、硫酸长春地辛合用，有时会引起气短及支气管痉挛。(3) 与多柔比星同时应用时可增加心脏毒性。

司来吉兰 Selegiline

(1) 与三环类抗抑郁药和（或）选择性 5- 羟色胺再摄取抑制药合用，可引起 5- 羟色胺综合征或自主神经功能紊乱等，应避免合用。(2) 与哌替啶合用可出现兴奋、出汗过多、肌强直、严重高血压。(3) 与左旋多巴合用可加强左旋多巴引起的异动症、恶心、直立性低血压、精神错乱及幻觉。

司莫司汀 Semustine

（1）与氯霉素、磺胺药合用，可加重骨髓抑制。与糖皮质激素合用，可加剧免疫抑制作用。（2）用药后3个月内不宜接种活疫苗。

四环素 Tetracycline

（1）含镁、铝、钙、铁、锌盐等制剂可减少四环素类的吸收。（2）抗酸药减少四环素类的吸收。（3）四环素类可能使香豆素类及茚二酮的抗凝作用增强。（4）四环素使阿托伐醌的血药浓度降低。（5）环素避免与利尿药合用。（6）四环素类与麦角制剂合用增加麦角中毒的危险性。（7）四环素类减少铁剂的吸收。（8）四环素类与维A酸类药合用可能增加良性颅内高压发生的危险性。（9）枸橼酸铋雷尼替丁、枸橼酸铋钾减少四环素类的吸收。

附录

羧苄西林 Carbenicillin

（1）抗痛风药：丙磺舒可使其血浆峰浓度和血浆半衰期分别增加和延长30%，使尿液中排出量减少48%。（2）大剂量与肝素、溶栓药、磺吡酮和抗血小板药联合应用可增加出血的危险。（3）与庆大霉素合用在体外可增强抗铜绿假单胞菌的活性；并对变形杆菌、不动杆菌、产碱杆菌属产生协同作用。与多黏菌素B合用，仅出现累加或轻度的拮抗作用；与妥布霉素、庆大霉素、阿米卡星联用对耐药的沙雷菌属产生协同作用。

羧甲司坦 Carbocisteine

应避免同时服用强镇咳药，以免痰液堵塞气道。

缩宫素 Oxytocin

（1）环丙烷等碳氢化合物吸入全麻时，使用缩宫素可导致产妇出现低血压，窦性心动过缓和（或）房室节律失常。恩氟烷浓度＞1.5%，氟烷浓度＞1.0%吸入全麻时，子宫对缩宫素的效应减弱。恩氟烷浓度＞3.0%可消除反应，并可导致子宫出血。（2）与前列腺素联用效果加强（但应注意监测），在阴道给予前列腺素类药物后6小时内不建议使用缩宫素。（3）其他宫缩药与缩宫素同用，可使子宫张力过高，产生子宫破裂和（或）宫颈撕裂。

索拉非尼 Sorafenib

（1）CYP3A4诱导剂（利福平、圣约翰草、苯妥英钠、苯巴比妥、地塞米松）可加快本品代谢。（2）华法林是CYP2C9的底物，合用时需监测INR值。（3）与多柔比星联用可使后者的平均AUC增加21%，与伊立替康合用，后者活性代谢产物SN-38的AUC升高67%～120%，伊立替康的AUC升高26%～42%。

索他洛尔 Sotalol

（1）I类抗心律失常药、吩噻嗪类、三环类抗抑郁药、特非那定：不宜与本品合用。（2）钙通道阻滞药：同用时可加重传导障碍，进一步抑制心室功能，降低血压。（3）儿茶酚胺类药：同用产生低血压和严重心动过缓。（4）胰岛素，降糖药：需增加胰岛素和降糖药的剂量。（5）地高辛：合用时有致心律失常作用。（6）β受体激动药：合用时可能需要增加用药剂量。

他达拉非 Tadalafil

（1）CYP3A4、CYP2C9、CYP2C19和CYP2D6抑制药如酮康唑、利托那韦、沙奎那韦、红霉素、克拉霉素、伊曲康唑等都可能增加他达拉非在血浆中的浓度。（2）CYP3A4的诱导剂：如利福平、苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平可减少血浆中他达拉非的浓度。（3）本品可增强硝酸酯类药物的降压作用。

他克莫司 Tacrolimus

（1）本品由CYP3A4代谢，因此在使用能抑制或诱导该酶的药物时应小心。（2）本品与两性霉素B和布洛芬能使肾毒性增强。（3）应避免与补钾利尿药和补钾药合用。在换用本品作为抢救用药时，应避免与ALG合用，以免发生淋巴细胞增殖性病变。（4）与其他对血浆白蛋白有高亲和力的药物（如口服抗凝药、降糖药）合用时也应谨慎。

他莫昔芬 Tamoxifen

(1) 可增强抗凝药作用。(2) 雌激素可影响本品治疗效果。(3) 与丝裂霉素合用发生溶血性血尿综合征的危险增加。(4) 与别嘌醇合用可加重本品肝毒性。(5) 与其他细胞毒性药物合用有增加血栓栓塞的危险。

他唑巴坦 Tazobactam

(1) 与妥布霉素合用可使哌拉西林的血浆半衰期和他唑巴坦的分布容积发生显著变化；哌拉西林-他唑巴坦可使妥布霉素的AUC降低11%，总体清除率升高12%和自尿液中的排出率降低40%。(2) 口服丙磺舒可使哌拉西林和他唑巴坦的肾清除率降低，两者的血浆半衰期分别延长21%和71%。

泰利霉素

(1) 利福霉素使泰利霉素的血浆药物浓度降低（利福霉素停药后2周内避免使用泰利霉素）。(2) 抗抑郁药贯叶金丝桃使泰利霉素的血浆药物浓度降低（贯叶金丝桃停药后2周内避免使用泰利霉素）。(3) 卡马西平、苯妥英钠及扑米酮使泰利霉素的血浆药物浓度降低（卡马西平、苯妥英钠、扑米酮停药后2周内避免使用泰利霉素）。(4) 泰利霉素与匹莫齐特合用增加室性心律失常发生的危险。(5) 泰利霉素可抑制咪达唑仑的代谢，血药浓度升高，镇静催眠作用增强。(6) 泰利霉素可能使阿瑞吡坦的血药浓度升高。(7) 苯巴比妥使泰利霉素的血药浓度降低（苯巴比妥停药后2周内避免使用泰利霉素）。(8) 泰利霉素可能使地高辛、环孢素、依普利酮的血药浓度升高，避免两者合用。(9) 泰利霉素与麦角胺合用增加麦角中毒发生的危险性。(10) 泰利霉素与阿托伐他汀或辛伐他汀合用增加肌病发生的危险性。(11) 泰利霉素可能使西地那非的血浆药物浓度升高。(12) 泰利霉素使西罗莫司、他克莫司的血药浓度升高。

坦度螺酮 Tandospirone

(1) 与氟哌啶醇合用可增强锥体外系症状。(2) 与钙通道阻滞药（如硝苯地平等）合用时可增强降压作用。

坦洛辛 Tamsulosin

与华法林、西咪替丁合用需谨慎。

碳酸钙 Kcalcium Carbonate

(1) 不宜与洋地黄类药物合用。(2) 乙醇、咖啡因、吸烟等可抑制钙剂的吸收。(3) 富含纤维素的食物能抑制钙的吸收。(4) 与苯妥英钠、四环素类同用，使后两药吸收减少。(5) 维生素D、避孕药、雌激素能增加钙的吸收。(6) 含铝抗酸药与本品同服，铝的吸收增多。(7) 本品与噻嗪类利尿药合用时，易发生高钙血症。

碳酸锂 Lithium Carbonate

(1) 与抗利尿药合用时，锂盐经肾脏排出减少，易出现锂中毒。(2) 与卡马西平、苯妥英钠、四环素、博来霉素和血管紧张素转换酶酶抑制（如卡托普利）合用时，可使血锂浓度升高。(3) 与非甾体抗炎药（如布洛芬、吲哚美辛）、乙醇和大多数抗精神病药合用，可导致血锂浓度升高，增加锂的毒性。(4) 本品与碘化物合用易引起甲状腺功能低下。(5) 与肌松药（如氯琥珀胆碱等）合用，肌松作用增强，作用时效延长。(6) 与去甲肾上腺素合用，后者的升压效应降低。(7) 与氨茶碱、咖啡因或碳酸氢钠合用，可增加本品的尿排出量，降低血浆药物浓度和药效。(8) 与氯丙嗪及其他吩噻嗪衍生物合用时，可使氯丙嗪的血浆药物浓度降低。(9) 与单胺氧化酶抑制药、选择性5-HT再摄取抑制药等抗抑郁药合用可导致5-HT综合征。

碳酸氢钠 Sodium Bicarbonate

(1) 合用糖皮质激素、促肾上腺皮质激素、雄激素时，易发生高钠血症和水肿。(2) 与苯丙胺、奎尼丁合用，后两者肾排泄减少，易出现毒性作用。(3) 与抗凝药如华法林和胆碱酯酶药等合用，使后者吸

收减少。(4)与含钙药物、乳及乳制品合用，可能发生乳-碱综合征。(5)与西咪替丁、雷尼替丁等H_2受体拮抗药合用，后者的吸收减少。(6)与排钾利尿药合用，增加发生低氯性碱中毒的危险性。(7)合用麻黄碱时应减小后者剂量。(8)与锂盐合用时，锂盐的用量应酌情增加。(9)能抑制乌洛托品转化成甲醛，从而抑制后者治疗作用。(10)本品可加速酸性药物的排泄。(11)本品可降低胃蛋白酶、维生素E的疗效。

特比萘芬 Terbinafine

(1)利福霉素使特比萘芬的血药浓度降低。(2)特比萘芬可能使丙米嗪与去甲替林的血药浓度升高。(3)偶见特比萘芬与雌激素合用出现突破性出血(用于避孕)；偶见特比萘芬与孕激素合用出现突破性出血(用于避孕)。(4)西咪替丁使特比萘芬的血药浓度升高。

特布他林 Terbutaline Sulphate

(1)与黄嘌呤类衍生物、糖皮质激素、利尿药合用可能增加低钾血症的危险。(2)合用其他肾上腺受体激动药和茶碱类药物可使疗效增加，但不良反应也可能加重。(3)非选择性β受体拮抗药(包括滴眼剂)可部分或全部抑制该药的作用。(4)避免与单胺氧化酶抑制药及抗抑郁药同时应用。(5)在氟烷麻醉中本品可诱发心律失常，联用需调节剂量。

特非那定 Terfenadine

(1)服用抗心律失常药或精神类药物的患者慎用。(2)不可与阿司咪唑联合应用。(3)肝酶抑制药如伊曲康唑、酮康唑以及大环内酯抗体可使本品代谢减慢，血浓度升高，易致心律失常。

特拉唑嗪 Terazosin

(1)利尿药或其他抗高血压药：合用降压作用增强。(2)与非甾体抗炎药合用降压作用可能减弱。(3)与5型磷酸二酯酶(PDE-5)抑制药合用会发生低血压。

替勃龙 Tibolone

酶诱导药物能加速本品代谢，降低替勃龙作用；可使抗凝药敏感性增强，停药后可恢复。

替卡西林-克拉维酸钾 Ticarcillin-Clavulanate Potassium

与丙磺舒同服可提高替卡西林血浆浓度，但对克拉维酸影响甚微。

替考拉宁 Teicoplanin

与氨基糖苷类抗生素合用，本品的耳、肾毒性增加。

替罗非班 Tirofiban

肝素和阿司匹林：联用时出血率增加。

替尼泊苷 Teniposide

(1)苯巴比妥和苯妥英钠可增加本品的清除率，对抗惊厥治疗的患者可增加替尼泊苷的用量。(2)甲苯磺丁脲、水杨酸钠和磺胺甲噻唑在体外可置换与血浆蛋白结合的替尼泊苷。

替普瑞酮 Teprenone

本品与H_2受体拮抗药合用时疗效增加。

替硝唑 Tinidazole

(见甲硝唑)

替扎尼定 Tizanidine

替扎尼定与降压药合用(包括利尿药)偶可引起低血压和心动过缓。乙醇或镇静药可以提高本品的镇静作用。

酮替芬 Ketotifen

避免将本品与多种中枢神经抑制药或乙醇并用，因可增强本品的镇静作用。不得与口服降糖药并用。

头孢吡肟 Cefepime

(1)丙磺舒可影响本品的排泄，可使血浆浓度升高。(2)与呋塞米等利尿药合用可能加重肾功能障碍。(3)与万古霉素

附录

联合应用可增强对葡萄球菌的杀菌活性；对甲氧西林敏感或耐甲氧西林的菌株产生协同作用。

头孢丙烯　Cefprozil

（1）与氨基糖苷类抗生素合用可增加肾毒性，与强效利尿药合用应谨慎。（2）与丙磺舒合用可使本品的 AUC 增加 1 倍。

头孢地秦　Cefodizime

丙磺舒可延缓头孢地秦自肾脏的排泄，与肾毒性药物联用宜注意观察肾脏功能。

头孢呋辛　Cefuroxime

（1）与高效利尿药如呋塞米联用，可致肾损害。（2）与丙磺舒并用，使头孢呋辛的有效浓度维持时间较长，同时使 AUC 增加 50%。

头孢克洛　Cefaclor

抑酸药能减少头孢克洛和头孢泊肟的吸收。

头孢克肟　Cefixime

头孢克肟可影响乙醇代谢，抑制乙醛脱氢酶的活性，使血中乙醛浓度上升，出现双硫仑样反应。

头孢硫脒　Cephathiamidine

本品肌内注射合用丙磺舒 1 g 后，12 小时尿排泄量降为给药量的 65.7%。

头孢米诺　Cefminox

(1)与利尿剂（呋塞米等）合用有可能增加肾毒性，应慎用。(2)本品可影响乙醇代谢，使血浆中乙醛浓度上升，显示双仑醒样作用，故用药期间或用药后禁酒。

头孢美唑　Cefmetazole

（1）与呋塞米等强效利尿药合用可增加肾损害。（2）本品可影响乙醇代谢，抑制乙醛脱氢酶的活性，使血浆中乙醛浓度上升，出现双硫仑样反应。

头孢匹罗　Cefpirome

(1)虽无证据表明正常剂量下头孢匹罗会影响肾功能，但如与某些药（如氨基糖苷类）合用，头孢菌素则有可能加强其肾毒性作用。(2)丙磺舒可影响肾小管对头孢匹罗的转运，从而延缓其排泄，增加其血浆浓度。

头孢曲松　Ceftriaxone

（1）与氨基糖苷类药合用，有协同抗菌作用；但可能加重肾损害。（2）与氯霉素合用，产生拮抗作用。（3）本品可影响乙醇代谢，使血中乙醛浓度上升，出现双硫仑样反应。

头孢噻肟　Cefotaxime

（1）与丙磺舒并用可使头孢噻肟的血浆半衰期延长 45%。（2）与强效利尿药合用，偶见加重肾损伤。（3）与庆大霉素、妥布霉素合用对铜绿假单胞菌有协同作用；与阿米卡星合用对大肠埃希菌、肺炎杆菌和铜绿假单胞菌有协同作用。

头孢西丁　Cefoxitin

（1）与其他头孢菌素、庆大霉素、卡那霉素、呋塞米等强效利尿药合用可增加肾损害。（2）与丙磺舒同用，可提高头孢西丁的血浆浓度并延长血浆半衰期。（3）本品可影响乙醇代谢，抑制乙醛脱氢酶的活性，使血浆中乙醛浓度上升，出现双硫仑样反应。

头孢唑啉　Cefazolin

（1）抗痛风药丙磺舒可抑制头孢唑林的自肾小管排泄，提高血浆浓度。（2）与强效利尿药和氨基糖苷类抗生素联用可加重肾毒性。

托吡酯　Topiramate

（1）在其他抗癫痫药（苯妥英钠、磷苯妥英钠、卡马西平、丙戊酸钠、扑米酮、苯巴比妥）基础上加用本品，一般不会改变它们的稳态血浆药物浓度；但个别情况下，在苯妥英钠基础上加用本品可升高苯妥英钠的血浆药物浓度。此外，苯妥英钠

及卡马西平可降低本品的血浆药物浓度，在苯妥英钠或卡马西平增减剂量和停药时，需注意调整本品剂量。(2) 本品可降低地高辛的血浆药物浓度，在加用或停药时应注意监测地高辛的血浆药物浓度。(3) 本品可降低口服避孕药的疗效。(4) 与乙酰唑胺联用会增加发生尿结石的危险。

托泊替康 Topotecan

(1) 与非格司亭 (G-CSF) 同用可延长中性粒细胞减少的持续时间，故在本品治疗后 24 小时才可使用 G-CSF。(2) 与顺铂联用可出现严重的骨髓抑制，与其他细胞毒药物合用亦应减量。

托拉塞米 Torasemide

(1) 水杨酸类药物：水杨酸高剂量组可观察到水杨酸毒性。(2) 吲哚美辛：抑制本品的促尿钠排泄作用。(3) 考来烯胺：动物实验中使口服本品的吸收率下降，不推荐两药合用。(4) 丙磺舒：同时服用使利尿作用下降。

托莫西汀 Tomoxetine

肝酶 CYP2D6 抑制药可增加托莫西汀的血浆药物浓度；与沙丁胺醇合用可使心率加快、血压升高。

托瑞米芬 Toremifene

与噻嗪类利尿药合用增加高钙血症。苯妥英钠、苯巴比妥和卡马西平可加速本品的代谢，合用时应增加剂量。与法华林等抗凝药合用可引起出血时间延长。对 CYP3A 有抑制作用的咪唑类药物，红霉素等可抑制本品代谢。

托特罗定 Tolterodine

(1) CYP3A4 抑制药如红霉素、克拉霉素、酮康唑、伊曲康唑、咪康唑，可降低本品代谢。(2) 抗胆碱药可增强本品作用和不良反应。反之毒蕈碱受体激动药可降低本品的疗效。

托西溴苄铵 Bretylium Tosilate

(1) 本品可增加洋地黄毒苷的毒性。(2) 与奎尼丁或普鲁卡因胺合用可相互拮抗。(3) 与肾上腺素，去甲肾上腺素及多巴胺合用，可使血压明显升高。(4) 三环类抗抑郁药可对抗连续用本品产生的血管扩张及血压下降作用。

妥布霉素 Tobramycin

(1) 与青霉素、头孢素合用，可增强对金葡菌、链球菌、铜绿假单胞菌、肠杆菌等的抗菌作用；与羧苄西林、哌拉西林联用，可增强对铜绿假单胞菌的抗菌活性，但与头孢噻吩合用，可能引起急性肾功能障碍。(2) 不宜与肝素联合使用。(3) 妥布霉素滴眼液与氨基糖苷类抗生素全身联合用药时，应注意监测血清中总的药物浓度。

妥拉唑林 Tolazoline

(1) 多巴胺：本品可拮抗大剂量多巴胺所致的外周血管收缩作用。(2) 麻黄碱：本品可降低麻黄碱的升压作用。(3) 肾上腺素、去甲肾上腺素：大剂量的本品与肾上腺素或去甲肾上腺素合用可导致反常性的血压下降随后发生反跳性的剧烈升高。(4) 间羟胺：本品可降低间羟胺升压作用。(5) 去甲肾上腺素：应用本品后，再应用去甲肾上腺素，可阻滞后者的升压作用，出现严重的低血压。(6) 甲氧明：应用本品后，再应用甲氧明，可阻滞后者的升压作用，出现严重的低血压。

万古霉素 Vancomycin

(1) 万古霉素静脉给药与全身麻醉药合用会发生高敏样反应。(2) 万古霉素与氨基糖苷类、卷曲霉素、多黏菌素、环孢素、两性霉素 B、顺铂、襻利尿药、他克莫司等合用增加肾毒性与耳毒性发生的危险性。(3) 考来烯胺抑制万古霉素的作用。(4) 万古霉素使氯琥珀胆碱的作用增强。

维 A 酸 Tretinoin

与其他角质剥脱剂交替使用可增加接触性皮炎的发生。与过氧苯甲酰在同一部位使用时，应早晚交替使用。

维库溴铵 Vecuronium Bromide

(1) 下列药物可增强本品效应：抗生

素，如氨基糖苷类、多肽类、酰脲青霉素类以及大剂量甲硝唑、利尿药、β肾上腺素能受体拮抗药、维生素 B_1、单胺氧化酶抑制药、奎尼丁、鱼精蛋白、α受体拮抗药、镁盐等。(2) 下列药物可使本品作用减弱：新斯的明、依酚氯铵、吡啶斯的明、氨基吡啶衍生物、长期使用皮质激素、苯胺类或卡马西平、去甲肾上腺素、硫嘌呤（仅有短暂、有限的作用）、茶碱、氯化钙。(3) 使用本品后，再给以去极化肌肉松弛药，如氯琥珀胆碱，可能加强或减弱本品的神经肌肉阻滞作用。

维拉帕米 Verapamil

(1) 细胞毒性药物（如环磷酰胺、长春新碱等）减少本品的口服吸收。(2) 抗癫痫药（苯巴比妥、卡马西平、扑米酮）可能使本品作用减弱。(3) 异烟肼：可显著降低本品生物利用度，作用减弱。(4) 利福平：加速本品的代谢，作用减弱。(5) β受体拮抗药：可能增强对房室传导、心率和心脏收缩的抑制作用，合用时需谨慎。(6) 其他抗高血压药：降压作用叠加。(7) 胺碘酮：增加心动过缓、房室传导阻滞和心肌抑制的风险。(8) 全身麻醉药：可增加本品降压和房室传导阻滞的作用，可能造成心脏的过度抑制。(9) 大环内酯类抗生素（红霉素、克拉霉素）：抑制本品的代谢，增加不良事件的风险。(10) 地高辛：本品能明显升高地高辛的血浆药物浓度，需减小地高辛的剂量。(11) 茶碱、环孢素：本品可增加茶碱及环孢素的血浆药物浓度。

维生素A Vitamin A

(1) 氢氧化铝、硫糖铝干扰维生素A的吸收。口服避孕药可提高血浆维生素A的浓度。(2) 与维生素E合用，可促进其吸收和利用。(3) 新霉素可能减少维生素A的吸收。(4) 维生素A与维A酸类药合用增加维生素A过多症发生的危险性。

维生素 B_{12} Vitamin B_{12}

(1) 与氯霉素合用可降低疗效，抵消维生素 B_{12} 的作用。(2) 维生素 B_{12} 缺乏者不宜大量摄入维生素C。(3) 氨基糖苷类抗生素、对氨水杨酸类、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮等抗惊厥药及秋水仙碱等可减少维生素 B_{12} 从肠道的吸收。

维生素 B_2 Vitamin B_2

饮酒影响肠道对维生素 B_2 的吸收。同用吩噻嗪类药、三环类抗抑郁药、丙磺舒等时，维生素 B_2 用量需增加。

维生素 B_6 Vitamin B_6

(1) 氯霉素、乙硫异烟胺、免疫抑制药、糖皮质激素、环磷酰胺、异烟肼等药物可拮抗维生素 B_6 或增加维生素 B_6 经肾排泄，可引起贫血或周围神经炎。(2) 本品可拮抗左旋多巴的抗震颤作用。维生素 B_6 使左旋多巴的作用减弱（禁合用多巴脱羧酶抑制药）。

维生素C Vitamin C

(1) 与肝素或华法林合用可引起凝血酶原时间缩短。(2) 与水杨酸类、苯巴比妥等合用，可促使维生素C的排泄增加。(3) 不宜与磺胺药合用。

维生素D Vitamin D

(1) 维生素D与卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠或扑米酮合用可能需要增加剂量。(2) 维生素D与噻嗪类或其他利尿药合用增加高钙血症发生的危险性。

维生素E Vitamin E

(1) 大剂量氢氧化铝、硫糖铝可降低脂溶性维生素E的吸收。(2) 避免香豆素类及其衍生物与大剂量本品同用。(3) 调血脂药考来烯胺和考来替泊、矿物油等可干扰其吸收。

维生素E烟酸酯 Vitamin E Nicotinate

(1) 氢氧化铝、硫糖铝、胆酸螯合剂：可干扰维生素E的吸收。(2) 香豆素类及其衍生物：避免与大量维生素E同用，以防止低凝血酶原血症发生。(3) 异烟肼：可阻止烟酸与辅酶I的结合，而致烟酸缺少。(4) 肾上腺素受体拮抗药：如胍乙啶等与烟酸合用时，其血管扩张作用增强，并可产生直立性低血压。

附录

维生素 K_1 Vitamin K_1

（1）与双香豆素类口服抗凝药合用，可干扰维生素 K 的代谢，并使作用相互抵消。(2)与较大剂量的水杨酸类、磺胺药、奎宁、奎尼丁、硫糖铝、考来烯胺、放线菌素 D 等合用，可影响本品的疗效。

伪麻黄碱 Pseudoephedrine Hydrochloride

应慎与其他拟交感神经药、减鼻充血药同时服用。

胃蛋白酶 Pepsin

（1）本品在中性、碱性及强酸性时，消化力较弱。(2）不宜与抗酸药物同服。(3）本品与硫糖铝相拮抗，不宜合用。

文拉法辛 Venlafaxine

（1）与单胺氧化酶抑制药合用可产生严重不良反应。(2）CYP 抑制药能升高本品的血浓度。(3）肝酶 CYP 诱导药能降低本品的血浓度。(4）本品对 CYP2D6 有较弱的抑制作用，与经 CYP2D6 代谢的药物合用时，应注意药物的剂量。(5）与三环类抗抑郁药合用，两者的毒性均增加。(6）与氯氮平、氟哌啶醇等药物合用，可增加药品不良反应。(7）与作用于 5-HT 能神经的药物合用，可导致中枢毒性或 5-HT 综合征。(8）与乙醇合用可加强中枢抑制作用。(9）与华法林合用，凝血酶原时间延长。(10)与西咪替丁合用，可使本品清除率降低。

乌拉地尔 Urapidil

（1）其他抗高血压药：同用增强本品降压作用。(2）西咪替丁：可使本品血浆药物浓度升高。(3）乙醇：饮酒可增强本品降压作用。

五氟利多 Penfluridol

（1）本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢抑制作用增强。(2）本品与抗高血压药合用，有增加直立性低血压的危险。(3）本品与三环类抗抑郁药合用时，可相互抑制代谢，并相互增强不良反应。(4）与锂盐合用可致无力、运动障碍、锥体外系症状、脑病和脑损伤等。

烯丙雌醇 Allylestrenol

谨慎与肝酶诱导剂合用，因为此类药可能会降低烯丙雌醇的药效。

西罗莫司 Sirolimus

(1) 西罗莫司在肠壁和肝脏最大限度地被 CYP3A4 同工酶代谢并被 P- 糖蛋白外排，所以本品的吸收和消除会因其他药物影响同工酶而受到影响。CYP3A4 的抑制剂（尼卡地平、维拉帕米、克霉唑、氟康唑和红霉素等）会降低西罗莫司的代谢，提高西罗莫司的血浆浓度。CYP3A4 诱导剂（卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠和利福平等）则会增加西罗莫司的代谢，降低西罗莫司的血浆浓度。(2) 与环孢素同时服用，可增加西罗莫司的血浆浓度，因此，本品应在环孢素口服液或环孢素胶囊给药后 4 小时服用。

西地那非 Sildenafil

（1）细胞色素 CYP3A4 抑制药（如酮康唑、红霉素、西咪替丁）会降低西地那非的清除。(2）CYP3A4 的诱导药（如利福平）降低本品血浆水平。

西洛他唑 Cilostazol

（1）前列地尔：合用有协同作用，增加细胞内环磷腺苷的浓度，增强本品的疗效。(2）肝酶 CYP 酶抑制药（酮康唑，红霉素等）：合用可使本品的血浆药物浓度升高，应注意减量，并从低剂量开始给药。

西咪替丁 Cimetidine

（1）影响其他药物的代谢，如华法林等。(2）胃肠局部用药可影响本品吸收，如抗酸药。(3）降低维生素 B_{12} 的吸收。

西酞普兰 Citalopram

（1）与乙醇或中枢抑制药合用能增加精神和运动功能损害的危险性。(2）CYP 诱导剂能加速本品的代谢，疗效降低。(3）与增强 5-HT 能神经功能的药物合用

可引起 5-HT 综合征。

西替利嗪 Cetirizine

同时服用中枢镇静药时应慎重。

腺苷 Adenosine

（1）双嘧达莫：可能增强和延长腺苷的作用，增加其毒性。（2）β 受体拮抗药、强心苷、钙通道阻滞药，腺苷受体拮抗药：不宜在至少 5 个半衰期内使用。（3）茶碱：可拮抗腺苷的抗心律失常作用。

腺苷钴胺 Cobamamide

（1）氯霉素可减少其吸收。（2）考来烯胺可结合维生素 B_{12} 减少其吸收。（3）与对氨水杨酸钠不能合用。

硝苯地平 Nifedipine

（1）肾上腺素 β 受体拮抗药：个别患者可能诱发和加重低血压、心力衰竭和心绞痛。（2）西咪替丁：抑制本品代谢，可使本品作用增强。（3）葡萄柚汁：抑制本品代谢，可使本品作用增强。（4）苯妥英钠：可使本品生物利用度降低，作用减弱。（5）西沙必利：可使本品作用增强。（6）利福平：可使本品生物利用度会降低，禁止与利福平合用。（7）地尔硫䓬：增加本品的血浆药物浓度，使本品作用增强。（8）地高辛：本品可增加地高辛的药物浓度。（9）其他抗高血压药：可使本品降压作用增强。

硝普钠 Sodium Nitroprusside

（1）其他抗高血压药：同用可使血压剧降。（2）多巴酚丁胺：同用可使心排血量增多而肺毛细血管楔压降低。（3）拟交感胺类：同用本品降压作用减弱。（4）西地那非：可加重本品的降压作用，禁止合用。（5）维生素 B_{12}：可预防本品的氰化物中毒反应及维生素 B_{12} 缺乏症。

硝酸甘油 Nitroglycerin

（1）抗高血压药、三环抗抑郁药、乙醇：可增强本类药的降血压效应。（2）双氢麦角碱：可加强双氢麦角碱的升压作用。（3）阿司匹林：可使本品作用增强。（4）皮质激素：可降低本品的疗效。（5）5 型磷酸二酯酶抑制药（西地那非）：显著加强本品的降压作用，禁止合用。

硝酸异山梨酯 Isosorbide Dinitrate

拟交感神经类药（肾上腺素、去氧肾上腺素、麻黄碱）可降低本品的抗心绞痛作用。其他见硝酸甘油项。

小牛血去蛋白提取物 Deproteinised Calf Blood Extractires

本品可能会减弱抗病毒药（如阿昔洛韦等）的药效。

小檗胺 Berbamine

（1）与氨硫脲合用，能增强氨硫脲的抗结核疗效。（2）对环磷酰胺的抗癌疗效有相加作用。

缬沙坦 Valsartan

（1）与阿替洛尔合用，降压效果增强，但与阿替洛尔单独用药相比不能进一步降低心率。（2）与留钾利尿药、钾盐或含钾盐代用品合用时，可使血钾升高。

辛伐他汀 Simvastatin

（1）CYP3A4 抑制药：如环孢素、伊曲康唑、酮康唑、红霉素、克拉霉素和奈法唑酮等合用时增加肌病的危险。（2）吉非贝齐：合用时增加肌病的危险，不推荐合用。（3）其他贝特类：合用时可能增加肌病的危险，应小心监测。（4）烟酸：当烟酸剂量大于一日 1g 时会增加肌病的危险。（5）香豆素类衍生物：本品能中毒提高香豆素类抗凝药的抗凝效果。

新斯的明 Neostigmine

（1）本品能抑制血浆中胆碱酯酶的活性，使酯族局麻药在体内水解缓慢，易导致中毒反应。（2）本品可降低琥珀酰胆碱的代谢，增加神经肌肉阻滞作用。（3）对氨基糖苷类抗生素、林可霉素、多黏菌素、利多卡因静脉注射或奎宁肌内注射，有程度不等的拮抗。（4）本品可减弱乙醚、恩氟烷、异氟烷、甲氧氟烷、环丙烷等吸入全麻药的肌松作用。（5）某些能干扰神经

肌肉传导的药物如奎尼丁能使本品作用减弱，不宜合用。

熊去氧胆酸 UrsodeoxycholicAcid

（1）避孕药可增加胆汁饱和度，用本品治疗时应尽量采取其他节育措施以免影响疗效。（2）考来烯胺、考来替泊和含铝抗酸药都能与鹅去氧胆酸结合，减少其吸收，不宜同用。

溴苄铵 Bretylium

（1）洋地黄：可增加洋地黄毒性，加重后者造成的心律失常。（2）肾上腺素、去甲肾上腺素及多巴胺：合用可使血压明显升高。（3）三环类抗抑郁药：可对抗连续用本品产生的血管扩张及血压下降作用。

溴丙胺太林 Propantheline Bromide

(1) 本品与甲氧氯普胺、多潘立酮不能合用。(2) 由于本品可延长胃排空时间，会对一些药物的吸收产生影响。红霉素可因在胃内停留过长而受到胃酸分解，降低疗效，对乙酰氨基酚的吸收可被延迟，血浆峰浓度降低；地高辛的血浆浓度可因合用本品而提高。

溴新斯的明 Neostigmine Bromide

(1) 本品不宜与去极化型肌松药合用。(2) 本品不宜与 β 受体阻断药合用。(3) 某些能干扰肌肉传递的药物如奎尼丁，能使本品作用减弱，不宜合用。

溴己新 Bromhexine

合用本品能增加四环素类抗生素在支气管中的分布浓度。

溴莫尼定 Atropine Sulfate

与中枢神经抑制药（如乙醇、巴比妥类药物、阿片制药、镇静药或麻醉药）产生相互或协同作用。

亚胺培南／西拉司丁 Imipenem-Cilastatin

与更昔洛韦合用增加惊厥发生的危险性。

亚砷酸 Arsenic Trioxide

避免与含硒药品或食品同用。

亚硝酸异戊酯 Amgl Nitrite

（见硝酸甘油）

亚叶酸钙 Calicum Folinate

较大剂量与苯巴比妥、扑米酮或苯妥英钠同用，可影响后三药的抗癫痫作用。

烟酸 Nicotinic Acid

（1）异烟肼：可阻止烟酸与辅酶 A 结合，而致烟酸缺少。（2）他汀类：合用会增加产生肌病甚至横纹肌溶解的风险，合用时需谨慎。（3）抗高血压药：与神经节阻断药、血管活性药、胍乙啶等肾上腺阻滞药合用，可引起直立性低血压。（4）吩噻嗪类衍生物：使吩噻嗪类衍生物作用增强。

烟酰胺 Nicotinamide

异烟肼与烟酰胺有拮抗作用，长期服用异烟肼应补充烟酰胺。

氧化镁 Magnesium Oxide

（1）与维生素 D 类同时服用可导致高钙血症。（2）干扰其他药物的吸收，如 H_2 受体拮抗药。(3)增加左旋多巴的吸收。

氧化亚氮 Nitrous Oxide

（1）本品与阿芬太尼、泮库溴铵、维库溴铵、筒箭毒碱、顺阿曲库铵、维拉帕米等有协同作用。（2）本品可能增加琥珀酰胆碱的神经肌肉阻滞作用。但不影响最大阻滞作用出现的时间。（3）麻醉性镇痛药有阻滞交感胺的作用，与氧化亚氮合用时可抑制氧化亚氮对交感神经的兴奋作用。（4）维生素 B_{12} 可部分对抗氧化亚氮的骨髓抑制作用。（5）常温下化学性质稳定，但氧化亚氮与氧气或可燃性麻醉药物混合有助燃性。

药用炭 Medicinal Charcoal

（1）作为解毒药应用时，禁止与吐根同用。（2）不宜与抗菌药物、维生素、磺

胺类、生物碱、乳酶生和消化酶合用。

叶酸　Folic Acid

（1）大剂量叶酸可使苯妥英钠、苯巴比妥和扑米酮的血浆药物浓度降低，并能拮抗苯巴比妥、苯妥英钠和扑米酮的抗癫痫作用，可使癫痫发作的临界值明显降低，并使敏感患者的发作次数增多。（2）抗肿瘤药：甲氨蝶呤、甲氧苄啶、乙胺嘧啶等对二氢叶酸还原酶有较强的亲和力，能阻止叶酸转化为四氢叶酸，中止叶酸的治疗作用。（3）抗溃疡性结肠炎药柳氮磺吡啶可能减少叶酸的吸收。（4）口服大剂量叶酸，可以影响微量元素锌的吸收。（5）与维生素 B_{12}、铁剂合用，可提高治疗贫血的疗效。

液状石蜡　Liquid Paraffin

由于同时应用多库酯钠可增加液状石蜡的吸收，因此不推荐两者同时应用。

伊立替康　Irinotecan

伊立替康具有抗胆碱酯酶活性，可延长氯琥珀胆碱的神经肌肉阻滞作用，而非去极化的神经肌肉阻滞作用则可能被拮抗。

伊马替尼　Imatinib

（1）CYP3A4 抑制药可增加本品的血浆浓度。（2）CYP3A4 诱导剂可降低本品血浆浓度。（3）本品使辛伐他汀（CYP3A4 底物）的平均 C_{max} 和 AUC 增加，与治疗窗窄的 CYP3A4 底物同用应谨慎。（4）本品可增加经 CYP3A4 代谢的药物的血浆浓度。（5）本品可抑制 CYP2D6 的活性，与 CYP2D6 底物同用时应谨慎。（6）本品可抑制 CYP2C9 和 CYP2C19，同用华法林等可见凝血酶原时间延长，应监测凝血酶原时间。（7）避免同用含有对乙酰氨基酚的药物。

伊托必利　Itopride

与抗胆碱药合用可能减弱本品的作用。

伊维菌素　Ivermectin

与阿苯达唑合用可增强对马来丝虫病和斑氏丝虫病的疗效。

依巴斯汀　Mizo lastine

红霉素可使本品的代谢物卡巴斯汀的血浆浓度上升 2 倍。

依降钙素　Elcatonin

与双膦酸盐类骨吸收抑制药合用，有可能急速降低血清钙，出现严重低钙血症。

依立雄胺　Epristeride

特拉唑嗪：可使本品 C_{max} 和 AUC 明显增加。

依米丁　Emetine

其他易引起心律异常的药物可加强本品的心脏毒性反应。

依那普利　Enalapril

（见卡托普利）

依那西普　Etanercept

（1）用药时接种活疫苗，可能由于细胞免疫反应被改变的，从而被活疫苗感染。不推荐患者同时接种活疫苗。（2）与阿那白滞素合用，可提高感染的风险。

依诺肝素　Enoxaparin

不推荐与以下药物合用：用于解热镇痛剂量的阿司匹林、非甾体抗炎药、噻氯匹定、右旋糖酐-40（肠道外使用）；与下列药物同时使用时需小心：口服抗凝药，溶栓剂，小剂量阿司匹林，糖皮质激素（全身用药）。

依沙吖啶　Ethacridine Lactate

与其他引产药如缩宫素合用，可导致软产道损伤。

依替米星　Etimicin

（1）与青霉素、头孢菌素联用，可增强对金葡菌、链球菌、大肠埃希菌、铜绿假单胞菌、克雷伯杆菌属、肠杆菌等的抗菌作用；但与氨苄西林、头孢呋辛、维生素 C 联用可降低本品的效价，应分开给药途径。（2）与右旋糖酐、海藻酸钠等联

用可能增加本品的肾毒性。

依托泊苷 Etoposide

（1）本品与血浆蛋白结合率高，与其他血浆蛋白结合率高的药物合用可影响本品代谢。（2）化疗结束后3个月内不宜接种疫苗。

依托咪酯 Etomidate

当与麻醉性镇痛药合用时，可出现不自主的肌肉强直或阵挛，但地西泮可减少其发生。

依西美坦 Exemestane

（1）本品经CYP3A4和醛酮还原酶代谢，故慎与经CYP3A4代谢和治疗窗窄的药物合用。（2）不可与雌激素类药物合用。

依折麦布 Ezetimibe

（1）考来烯胺：合用可能会降低依折麦布的作用。应在服用胆酸螯合剂之前2小时以上或在服用之后4小时以上服用依折麦布。（2）环孢素：可能会增强依折麦布的作用。

胰岛素 Insulin

（1）糖皮质激素、促糖皮质激素、胰高血糖素、雌激素、口服避孕药、肾上腺素、苯妥英钠、噻嗪类利尿药、甲状腺素等可不同程度地升高血糖浓度，同用时应调整这些药或胰岛素的剂量。（2）口服降糖药与胰岛素有协同降血糖作用。（3）抗凝药、水杨酸盐、磺胺类药及抗肿瘤药甲氨蝶呤等可与胰岛素竞争和血浆蛋白结合，从而使血液中游离胰岛素水平增高。非甾体抗炎药可增强胰岛素降血糖作用。（4）β受体拮抗药如普萘洛尔可阻止肾上腺素升高血糖的反应，干扰机体调节血糖功能，与胰岛素同用可增加低血糖的危险，而且可掩盖低血糖的症状，延长低血糖时间。合用时应注意调整胰岛素剂量。（5）中等量至大量的乙醇可增强胰岛素引起的低血糖的作用，可引起严重、持续的低血糖，在空腹或肝糖原储备较少的情况下更易发生。（6）氯喹、奎尼丁、奎宁等可延缓胰岛素的降解，在血中胰岛素浓度升高从而加强其降血糖作用。（7）升血糖药如某些钙通道阻滞药、可乐定、丹那唑、二氮嗪、生长激素、肝素、H_2受体拮抗药、吗啡、磺吡酮等可改变糖代谢，使血糖升高，因此胰岛素同上述药物合用时应适当加量。（8）血管紧张素转换酶抑制药、溴隐亭、氯贝丁酯、酮康唑、锂盐、甲苯达唑、维生素B_6、茶碱等可通过不同方式直接或间接致血糖降低，胰岛素与上述药物合用时应适当减量。（9）奥曲肽可抑制生长激素、胰高血糖素及胰岛素的分泌，并使胃排空延迟及胃肠道蠕动减缓，引起食物吸收延迟，从而降低餐后血糖，在开始用奥曲肽时，胰岛素应适当减量，以后再根据血糖调整。

胰激肽原酶 Pancreatic Kininogenase

（1）蛋白酶抑制药：本品与蛋白酶抑制药不能同时使用。（2）血管紧张素转换酶抑制药：本品与血管紧张素转换酶抑制药（ACEI）有协同作用。(3)本品与蛋白酶抑制剂不能同时使用。(4)本品与血管紧张素转换酶抑制剂(ACEI)有协同作用。

胰酶 Pancereatin

（1）本品与等量碳酸氢钠同服可增强疗效。（2）雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁等与胰酶合用时可能需要减少胰酶剂量。（3）忌与稀盐酸等酸性药物同服。（4）与阿卡波糖合用时，使后者的药效降低，故应避免同时使用。（5）本品与吡格列酮合用时，后者的药效降低，故应避免同时使用。（6）胰酶可干扰叶酸的吸收。

乙胺丁醇 Ethambutol

(1)与氢氧化铝合用可减少本品吸收。（2）与利福平、异烟肼合用可增强抗结核菌活性和延迟耐药性的产生。（3）与有神经毒性的药物合用可增加本品对神经的毒性，如视神经炎或周围神经炎。

乙胺嘧啶 Pyrimethamine

与磺胺多辛或砜类药物合用，则对疟原虫的叶酸代谢起双重阻断作用，以减少耐药性的产生。

乙胺嗪　Diethylcarbamazine

与卡巴胂合用，可增强。

异帕米星　Isepamicin

(1) 与其他氨基糖苷类抗生素合用或先后连续局部或全身应用，可增加耳毒性、肾毒性及神经肌肉阻滞作用。可能发生听力减退，停药后仍可能进展至耳聋；听力损害可能恢复或呈永久性。神经肌肉阻滞作用可导致骨骼肌软弱无力、呼吸抑制或呼吸麻痹（呼吸暂停），用抗胆碱酯酶药或钙盐有助于阻滞作用恢复。(2) 与神经肌肉阻滞药合用，可加重神经肌肉阻滞作用，导致肌肉软弱、呼吸抑制或呼吸麻痹(呼吸暂停)。(3) 与血容量扩充药如右旋糖酐、海藻酸钠，利尿药如依他尼酸、呋塞米及卷曲霉素、顺铂、万古霉素等合用，或先后连续局部或全身应用，可增加耳毒性与肾毒性，可能发生听力损害，且停药后仍可能发展至耳聋，听力损害可能恢复或呈永久性。(4) 与头孢噻吩局部或全身合用可能增加肾毒性。(5) 与多黏菌素合用，或先后连续局部或全身应用，因可增加肾毒性和神经肌肉阻滞作用，后者可导致骨骼肌软弱无力，呼吸抑制或呼吸麻痹(呼吸暂停)。(6) 本品不宜与其他肾毒性或耳毒性药合用或先后应用，以免加重肾毒性或耳毒性。(7) 本品不宜与两性霉素B、头孢噻吩钠、呋喃妥因钠、磺胺嘧啶钠和盐酸四环素等(以上均为注射液)联合应用，因可发生配伍禁忌。(8) 与β内酰胺类(头孢菌素类或青霉素类)合用常可获得协同作用。但混合可导致相互失活，需联合应用时须分瓶单独滴注。

乙哌立松　Eperisone

与美索巴莫、盐酸甲苯哌丙酮合用，可能发生眼调节障碍。

乙酰半胱氨酸　Acetylcysteine

应避免同服强力镇咳药。

异丙嗪　Promethazine

(1) 乙醇、中枢神经抑制药特别是麻醉药、巴比妥类、单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药同用时药效增加，需要调整用量。(2) 同用阿托品类药时，抗毒蕈碱样效应增加。(3) 与溴苄铵、胍乙啶同用，降压效应增强。与肾上腺素同用时，可使其α作用被阻断、β作用占优势。(4) 与顺铂、巴龙霉素及其他氨基糖苷类抗生素、水杨酸制剂和万古霉素等同用时，其耳毒性症状可被掩盖。(5) 不宜与氨茶碱混合注射。

异丙肾上腺素　Isoprenaline

(1) 与其他拟肾上腺素药合用可增效，但不良反应也增多。(2) 普萘洛尔拮抗本品的作用。

异丙托溴铵　Ipratropium Bromide

(1) β受体激动药和黄嘌呤制剂能增强本品的支气管扩张作用。(2) 与β受体激动药合用时，有闭角型青光眼病史的患者可能增加急性青光眼发作的危险。

异氟烷　Isoflurane

(1) 异氟烷可延长肌松药的作用。(2) 异氟烷与干燥的二氧化碳吸收物作用后，可产生一氧化碳。

异甘草酸镁　Magnesium Isoglycyrrhizinate

与依他尼酸、呋塞米等噻嗪类及三氯甲噻嗪、氯噻酮等降压利尿剂合用时，其利尿作用可增强本品的排钾作用，易导致血清钾值的下降，应注意观察血清钾值的测定等。

异环磷酰胺　Ifosfamide

先前应用顺铂患者，可加重异环磷酰胺的骨髓抑制、神经毒性和肾毒性。同时使用抗凝药物，可能导致出血危险。同时使用降血糖药，可增强降血糖作用。与其他细胞毒药合用，应酌情减量。使用本品期间不能接种活疫苗。与别嘌醇及氢氯噻嗪合用，加重骨髓抑制。用药期间避免饮用西柚汁。之前或同时使用苯巴比妥、苯妥英钠、水合氯醛可加速本品代谢。本品增强琥珀胆碱的肌松作用。

异维A酸 Isotretinoin

避免与四环素类药物同用。

异烟肼 Isoniazid

(1) 抗酸药尤其是氢氧化铝可抑制本品吸收。(2) 本品与利福平、乙酰氨基酚、卡马西平同用，可增加后者的不良反应；与利福平合用，可致肝脏功能异常，尤其是对已有肝功能异常者或对异烟肼快乙酰化者，因此，在治疗初始3个月应密切观察肝毒性的征兆；与环丝氨酸同服可增加对中枢神经系统的不良反应，宜调整剂量并密切观察；与乙硫异烟胺和其他抗结核药合用，可加重后两者的不良反应。(3) 与其他具有肝毒性的药物合用，可增加本品对肝脏的毒性反应。(4) 与糖皮质激素（如泼尼松龙）联合应用，可增加本品在肝脏的代谢，血浆浓度降低而影响疗效，对异烟肼快乙酰化者尤为如此。(5) 与阿芬太尼、苯妥英钠或氨茶碱合用可使后者的作用增强。(6) 与酮康唑或咪康唑合用可使后两药的药效降低。(7) 本品可加强抗癫痫药、抗高血压药、抗胆碱药和三环抗抑郁药的作用。(8) 与双香豆素、茚满酮衍生物同用，可抑制抗凝药的代谢，抗凝血作用增强。

抑肽酶 Aprotinin

(1) 本品可抑制ACEI类（卡托普利）的降压效果。(2) 与阿普替酶、阿尼普酶、链激酶、尿激酶合用，与本品的作用拮抗，本品可用来抑制上述药物引起的出血。(3) 本品可加强神经肌肉阻滞药的作用，使凝血时间延长。

银杏叶提取物 Ginkgo Biloba Leaf Extract

慎与抗血小板药与抗凝药并用。

吲达帕胺 Indapamide

(1) 糖皮质激素可降低本品的利尿利钠作用。(2) 胺碘酮可因血钾低而易致心律失常。(3) 口服抗凝药：可使抗凝效应减弱。(4) 非甾体抗炎药可使本品的利钠作用减弱。(5) 多巴胺：可使利尿作用增强。(6) 其他种类抗高血压药：可增强降压作用。(7) 拟交感药：可减弱降压作用。(8) 与二甲双胍合用易出现乳酸酸中毒。

吲哚美辛 Indometacin

(1) 与对乙酰氨基酚长期合用可增加肾毒性，与其他非甾体抗炎药同用时消化道溃疡的发病率增高。(2) 与阿司匹林或其他水杨酸盐同用时并不能加强疗效，而胃肠道不良反应则明显增多，由于抑制血小板聚集的作用加强，可增加出血倾向。(3) 饮酒或与糖皮质激素、促糖皮质激素同用，可增加胃肠道溃疡或出血的危险。(4) 与洋地黄类药同用时，本品可使洋地黄的血浆浓度升高（因抑制从肾脏的清除）而增加毒性，因而需调整洋地黄剂量。(5) 与肝素、口服抗凝药及溶栓药合用时，因本品与之竞争性结合蛋白，使抗凝作用加强。同时本品有抑制血小板聚集作用，因此有增加出血的潜在危险。(6) 本品与胰岛素或口服降糖药合用，可加强降糖效应、须调整降糖药物的剂量。(7) 与呋塞米同用时，可减弱后者排钠及抗高血压作用。其原因可能是由于抑制了肾脏内前列腺素的合成，本品还有阻止呋塞米、布美他尼及吲达帕胺等对血浆肾素活性增强的作用，对高血压病人评议其血浆肾素活性的意义时应注意此点。(8) 与氨苯蝶啶合用时可致肾功能减退（肌酐清除率下降、氮质血症）。(9) 与硝苯地平或维拉帕米同用时，可致后两者血浆药物浓度增高，因而毒性增加。(10) 丙磺舒可减少本品自肾及胆汁的清除，增高血浆药物浓度，使毒性增加，合用时须减量。(11) 与秋水仙碱、磺吡酮合用时可增加胃肠溃疡及出血的危险。(12) 与锂盐同用时，可减少锂自尿排泄，使血浆药物浓度增高，毒性加大。(13) 本品可使甲氨蝶呤血浆药物浓度增高，并延长高血浆浓度时间。正在用本品的病人如需做中或大剂量甲氨蝶呤治疗，应于应用前24～48小时停用本品，以免增加其毒性。(14) 与抗病毒药齐多夫定同用时，可使后者清除率降低，毒性增加。同时本品的毒性也增加，故应避免合用。

附录

蚓激酶 Lumbrokinase

与抑制血小板功能的药物有协同作用，使后者的抗凝作用增强。

罂粟碱 Papaverine

（1）可阻断多巴胺受体，与左旋多巴合用时可降低后者疗效。（2）吸烟可降低本品疗效。

右美沙芬 Dextromethorphan

（1）不能与抗抑郁药物并用。（2）不宜与乙醇及其他中枢神经系统抑制药物并用，因可增强对中枢的抑制作用。

右旋糖酐铁 Iron Dextran

与依那普利合用可加重本品所致的全身不良反应。

右佐匹克隆 Deszopiclone

（1）与奥氮平合用，可使右佐匹克隆的 DSST 评分降低，为药效的改变而非药代动力学的改变。（2）CYP3A4 为右佐匹克隆消除的主要代谢酶，与酮康唑（CYP3A4 的强抑制剂）合用，可使右佐匹克隆药 - 时曲线下面积（AVC）增加 2.2 倍，血浆峰浓度和半衰期分别增加 1.4 倍和 1.3 倍。与其他 CYP3A4 的强抑制药（伊曲康唑、克拉霉素、奈法唑酮、竹桃霉素、利托那韦、奈非那韦）合用，也可能产生相似的作用。（3）与肝酶 CYP3A4 诱导药（利福平）合用，可使消旋佐匹克隆暴露率降低 80%。右佐匹克隆也可能产生相似的作用。

鱼精蛋白 Protamine

（1）鱼精蛋白可延长胰岛素的作用。（2）与肝素合用，形成肝素与鱼精蛋白结合物，可拮抗肝素的抗凝血作用。

孕三烯酮 Gestrinone

同时服用抗癫痫药或利福平，可能加快本品的代谢。

扎鲁司特 Zafirlukast

（1）与红霉素、茶碱、特非那丁合用使扎鲁司特血浓度降低。极少数患者合用茶碱后出现茶碱水平升高。（2）合用华法林可导致凝血酶原时间延长约 35%，应密切监测 INR。（3）食物能降低扎鲁司特的生物利用度，应避免进食时服用。

脂肪乳注射液（$C_{14\sim24}$）Fat Emulsion Injection（$C_{14\sim24}$）

（1）本品与多价阳离子（如钙离子）混合时，如浓度不合适，可能出现不相容性，尤其是与肝素同用时；使用本品有可能导致出血时间延长与血小板凝集异常，必要时可减少抗凝药的剂量。（2）一般长链脂肪乳注射液中含大豆油，大豆油天然含有维生素 K_1，对香豆素类药物的治疗效果可能有影响。

脂溶性维生素注射液（Ⅰ）Fat-soluble Vitamin Injection Ⅰ

本品含维生素 K_1，可与香豆素类、肝素等抗凝血药发生相互作用。

注射用水溶性维生素 Water-soluble Vitamin for Injection

（1）本品所含维生素 B_6 能降低左旋多巴的作用。（2）本品所含叶酸可能降低苯妥英钠的血浆浓度和掩盖恶性贫血的临床表现。

紫杉醇 Paclitaxel

（1）本品先于顺铂使用时骨髓抑制加重，在顺铂之后使用清除率降低约 33%。（2）慎与 CYP2C8 和 CYP3A4 的底物或抑制药同用。（3）有报道本品与多柔比星合用可能提高后者血浆药物浓度。

左氨氯地平 Benazepril

（见氨氯地平）

左奥硝唑 Levornidazole

（1）同其他硝基咪唑类药相比，本品对乙醛脱氢酶无抑制作用。（2）因为有报道奥硝唑能抑制抗凝血药华法林的代谢，使其半衰期延长，增强抗凝血药的药效，当与华法林合用时，应注意观察凝血酶原

时间并调整给药剂量。

左布比卡因

Levobupivacaine Hydrochloride

有可能左布比卡因的代谢机制受已知的肝酶 CYP3A4 诱导剂（如苯妥英钠、苯巴比妥、利福平等）、肝酶 CYP3A4 抑制药，肝酶 CYP1A2 诱导剂（奥美拉唑等）和肝酶 CYP1A2 抑制药的影响。

左旋甲状腺素 Levothyroxine

(1) 左甲状腺素钠可增加抗凝血药的作用。(2) 左甲状腺素钠可升高苯妥英钠的血浆浓度。(3) 与抗惊厥药卡马西平和苯妥英钠合用，可加快左甲状腺素钠代谢，可将甲状腺素从血浆蛋白中置换出来。(4) 与强心苷合用，须相应调整强心苷用量。(5) 左甲状腺素钠也会增加拟交感性药物的作用。(6) 左甲状腺素钠可增加儿茶酚胺受体敏感性，因此会增强三环抗抑郁药的作用。(7) 消胆胺可降低左甲状腺素钠吸收；同时合用口服避孕药，需增加本品的用量。

左旋咪唑 Levamisole

与噻嘧啶合用可治疗严重的钩虫感染，并可提高驱除美洲钩虫的效果。与噻苯达唑合用可治疗肠线虫混合感染；与乙胺嗪先后序贯应用，可治用于抗丝虫感染。

唑来膦酸 Zoledronic Acid

(1) 与氨基糖苷类抗生素合用时应慎重，因氨基糖苷类具有降低血钙的协同作用，可能延长低血钙持续时间。(2) 与利尿剂合用时可能会增大低血钙的危险性。(3) 与沙利度胺合用时会增加多发性骨髓瘤患者肾功能异常的危险性。

佐米曲普坦 Zolmitriptan

（1）与吗氯贝胺（单胺氧化酶抑制药）合用，本品作用增强。（2）西咪替丁可抑制本品的代谢。（3）普萘洛尔可抑制本品的代谢。（4）与复方磺胺甲噁唑、氟哌利多、红霉素、红霉素／磺胺异噁唑合用，可致心电图 QT 间期延长，心脏毒性增加。(5) 与选择性 5-HT 再吸收抑制药（SSRI）合用，可能导致不良反应（虚弱、反射亢进和肌肉运动失调等）增加。

佐匹克隆 Zopiclone

（1）与肌松药或其他中枢神经抑制药同用会增强镇静作用。（2）与苯二氮䓬类抗焦虑药或催眠药同用，戒断症状的出现可增加。

唑吡坦 Zolpidem

（1）饮酒或与中枢神经抑制药物合并应用时，增加该药的镇静作用，用量应当减少。（2）与氯丙嗪合用可延长氯丙嗪的血浆半衰期和血浆清除时间。（3）与丙米嗪合用可以增加嗜睡反应和逆行遗忘的发生，并降低丙米嗪的血浆峰浓度。

另外，抗甲状腺类药物的相互作用见附表 2-1，甲状腺激素类药物的相互作用见附表 2-2。

附表 2-1 抗甲状腺类药的相互作用

相互作用的药物		相互作用的结果
丙硫氧嘧啶、甲巯咪唑、卡比马唑	磺胺类、对氨水杨酸、巴比妥类、酚妥拉明、妥拉唑林、维生素 B_{12}、磺酰脲类	与有抑制甲状腺功能和引起甲状腺肿大作用的药物合用须注意
	碘剂	在用本品前避免服用碘剂
	抗凝药	抗凝作用增强

附表 2-2　甲状腺激素类药物的相互作用

相互作用的药物		相互作用的结果
甲状腺片、碘塞罗宁、左甲状腺素	口服降血糖药	使降糖效果降低
	苯妥英钠、阿司匹林、双香豆素类	与血浆蛋白产生竞争性结合，增加这些药物在血浆中的游离量，从而增强其作用，加重不良反应甚至发生意外
	三环类抗抑郁药	两类药的作用和不良反应均增强
	雌激素或避孕药	因血液中甲状腺素结合球蛋白水平增加，合用时甲状腺激素剂量应适当增加
	考来烯胺或考来替泊	减弱甲状腺激素的作用，两类药伍用时，应间隔 4～5 小时服用，并定期测定甲状腺功能
	β 受体拮抗药	β 肾上腺素受体拮抗药可减少外周组织 T_4 向 T_3 的转化，合用时应予注意

附录 3

国家基本药物目录
（基层医疗卫生机构配备使用部分）
2009 版化学药品与生物制品部分

一、抗微生物药

（一）青霉素类

1. 青霉素 Benzylpenicillin（注射剂）
2. 苯唑西林 Oxacillin（注射剂）
3. 氨苄西林 Ampicillin（注射剂）
4. 哌拉西林 Piperacillin（注射剂）
5. 阿莫西林 Amoxicillin（口服常释剂型）
6. 阿莫西林克拉维酸钾 Amoxicillin and Clavulanate. Potassium（口服常释剂型）

（二）头孢菌素类

7. 头孢唑林 Cefazolin（注射剂）
8. 头孢氨苄 Cefalexin（口服常释剂型、颗粒剂）
9. 头孢呋辛 Cefuroxime（口服常释剂型、注射剂）[注释1]
10. 头孢曲松 Ceftriaxone（注射剂）

（三）氨基糖苷类

11. 阿米卡星 Amikacin（注射剂）
12. 庆大霉素 Gentamycin（注射剂）

（四）大环内酯类

13. 红霉素 Erythromycin（口服常释剂型、注射剂）
14. 阿奇霉素 Azithromycin（口服常释剂型、颗粒剂）

（五）其他抗生素

15. 克林霉素 Clindamycin（口服常释剂型、注射剂）
16. 磷霉素 Fosfomycin（注射剂）

（六）磺胺类

17. 复方磺胺甲噁唑 Compound Sulfamethoxazole（口服常释剂型）

（七）喹诺酮类

18. 诺氟沙星 Norfloxacin（口服常释剂型）
19. 环丙沙星 Ciprofloxacin（口服常释剂型、注射剂）
20. 左氧氟沙星 Levofloxacin（口服常释剂型、注射剂）

（八）硝基呋喃类

21. 呋喃妥因 Nitrofurantoin（口服常释剂型）

（九）抗结核病药

22. 异烟肼 Isoniazid（口服常释剂型、注射剂）
23. 利福平 Rifampicin（口服常释剂型）
24. 吡嗪酰胺 Pyrazinamide（口服常释剂型）
25. 乙胺丁醇 Ethambutol（口服常释剂型）
26. 链霉素 Streptomycin（注射剂）
27. 对氨基水杨酸钠 Sodium Aminosalicylate（口服常释剂型、注射剂）

（十）抗麻风病药

28. 氨苯砜 Dapsone（口服常释剂型）

（十一）抗真菌药

29. 氟康唑 Fluconazole（口服常释剂型）
30. 制霉素 Nysfungin（口服常释剂型）

（十二）抗病毒药

31. 阿昔洛韦 Aciclovir（口服常释剂型）
32. 利巴韦林 Ribavirin（口服常释剂型、颗粒剂、注射剂）
33. 抗艾滋病用药[注释2]

二、抗寄生虫病药

（一）抗疟药

34. 氯喹 Chloroquine（口服常释剂型、注射剂）
35. 伯氨喹 Primaquine（口服常释剂型）
36. 青蒿素类药物[注释3]

（二）抗阿米巴病药及抗滴虫病药

37. 甲硝唑 Metronidazole（口服常

释剂型、注射剂）

（三）抗利什曼原虫病药

38. 葡萄糖酸锑钠 Sodium Stibogluconate（注射剂）

（四）抗血吸虫病药

39. 吡喹酮 Praziquantel（口服常释剂型）

（五）驱肠虫药

40. 阿苯达唑 Albendazole（口服常释剂型）

三、麻醉药

（一）局部麻醉药

41. 利多卡因 Lidocaine（注射剂）
42. 布比卡因 Bupivacaine（注射剂）
43. 普鲁卡因 Procaine（注射剂）

（二）全身麻醉药

44. 氯胺酮 Ketamine（注射剂）

四、镇痛、解热、抗炎、抗风湿、抗痛风药

（一）镇痛药

45. 芬太尼 Fentanyl（注射剂）
46. 哌替啶 Pethidine（注射剂）

（二）解热镇痛、抗炎、抗风湿药

47. 对乙酰氨基酚 Paracetamol（口服常释剂型、颗粒剂）
48. 阿司匹林 Aspirin（口服常释剂型）
49. 布洛芬 Ibuprofen（口服常释剂型）
50. 双氯芬酸 Diclofenac（口服常释剂型、口服缓释剂型）
51. 吲哚美辛 Indometacin（栓剂）

（三）抗痛风药

52. 别嘌醇 Allopurinol（口服常释剂型）
53. 秋水仙碱 Colchicine（口服常释剂型）

五、神经系统用药

（一）抗帕金森病药

54. 金刚烷胺 Amantadine（口服常释剂型）
55. 苯海索 Benzhexol（口服常释剂型）

（二）抗重症肌无力药

56. 新斯的明 Neostigmine（注射剂）

（三）抗癫痫药

57. 卡马西平 Carbamazepine（口服常释剂型）
58. 丙戊酸钠 Sodium Valproate（口服常释剂型）
59. 苯妥英钠 Phenytoin Sodium（口服常释剂型、注射剂）
60. 苯巴比妥 Phenobarbital（口服常释剂型、注射剂）

（四）脑血管病用药及降颅压药

61. 尼莫地平 Nimodipine（口服常释剂型）
62. 麦角胺咖啡因 Ergotamine and Caffeine（口服常释剂型）
63. 甘露醇 Mannitol（注射剂）

（五）镇静催眠药

64. 地西泮 Diazepam（口服常释剂型、注射剂）

（六）其他

65. 胞磷胆碱 Citicoline（注射剂）
66. 尼可刹米 Nikethamide（注射剂）
67. 洛贝林 Lobeline（注射剂）

六、治疗精神障碍药

（一）抗精神病药

68. 奋乃静 Perphenazine（口服常释剂型、注射剂）
69. 氯丙嗪 Chlorpromazine（口服常释剂型、注射剂）
70. 氟哌啶醇 Haloperidol（口服常释剂型、注射剂）

（二）抗焦虑药

71. 艾司唑仑 Estazolam（口服常释剂型）

（三）抗抑郁药

72. 阿米替林 Amitriptyline（口服常释剂型）
73. 多塞平 Doxepin（口服常释剂型）

七、心血管系统用药

（一）抗心绞痛药

74. 硝酸甘油 Nitroglycerin（口服常释剂型、注射剂）
75. 硝酸异山梨酯 Isosorbide Dinitrate（口服常释剂型、注射剂）
76. 硝苯地平 Nifedipine（口服常释

剂型）

（二）抗心律失常药

77. 美西律 Mexiletine（口服常释剂型）

78. 普罗帕酮 Propafenone（口服常释剂型、注射剂）

79. 普鲁卡因胺 Procainamide（注射剂）

80. 普萘洛尔 Propranolol（口服常释剂型）

81. 阿替洛尔 Atenolol（口服常释剂型）

82. 美托洛尔 Metoprolol（口服常释剂型、注射剂）

83. 胺碘酮 Amiodarone（口服常释剂型、注射剂）

84. 维拉帕米 Verapamil（口服常释剂型、注射剂）

（三）抗心力衰竭药

85. 地高辛 Digoxin（口服常释剂型、注射剂）

86. 去乙酰毛花苷 Deslanoside（注射剂）

（四）抗高血压药

87. 卡托普利 Captopril（口服常释剂型）

88. 依那普利 Enalapril（口服常释剂型）

89. 硝普钠 Sodium Nitroprusside（注射剂）

90. 硫酸镁 Magnesium Sulfate（注射剂）

91. 尼群地平 Nitrendipine（口服常释剂型）

92. 吲达帕胺 Indapamide（口服常释剂型、口服缓释剂型）

93. 酚妥拉明 Phentolamine（注射剂）

94. 复方利血平 Compound Reserpine（口服常释剂型）

95. 复方利血平氨苯蝶啶 Compound Hypotensive（口服常释剂型）

（五）抗休克药

96. 肾上腺素 Adrenaline（注射剂）

97. 去甲肾上腺素 Noradrenaline（注射剂）

98. 异丙肾上腺素 Isoprenaline（注射剂）

99. 间羟胺 Metaraminol（注射剂）

100. 多巴胺 Dopamine（注射剂）

101. 多巴酚丁胺 Dobutamine（注射剂）

（六）调脂及抗动脉粥样硬化药

102. 辛伐他汀 Simvastatin（口服常释剂型）

八、呼吸系统用药

（一）祛痰药

103. 溴己新 Bromhexine（口服常释剂型）

104. 氨溴索 Ambroxol（口服常释剂型、口服溶液剂）

（二）镇咳药

105. 喷托维林 Pentoxyverine（口服常释剂型）

106. 复方甘草 Compound Liquorice（口服常释剂型、口服溶液剂）

（三）平喘药

107. 沙丁胺醇 Salbutamol（气雾剂、雾化溶液剂）

108. 氨茶碱 Aminophylline（口服常释剂型、口服缓释剂型、注射剂）

109. 茶碱 Theophylline（口服常释剂型、口服缓释剂型）

九、消化系统用药

（一）抗酸药及抗溃疡病药

110. 复方氢氧化铝 Compound Aluminium Hydroxide（口服常释剂型）

111. 雷尼替丁 Ranitidine（口服常释剂型、注射剂）

112. 法莫替丁 Famotidine（口服常释剂型、注射剂）

113. 奥美拉唑 Omeprazole（口服常释剂型）

114. 枸橼酸铋钾 Bismuth Potassium Citrate（口服常释剂型）

（二）助消化药

115. 乳酶生 Lactasin（口服常释剂型）

（三）胃肠解痉药及胃动力药

116. 颠茄 Belladonna（口服常释剂型、

酊剂）

117. 山莨菪碱 Anisodamine（口服常释剂型、注射剂）

118. 阿托品 Atropine(口服常释剂型、注射剂）

119. 多潘立酮 Domperidone（口服常释剂型）

120. 甲氧氯普胺 Metoclopramide(口服常释剂型、注射剂）

（四）泻药及止泻药

121. 开塞露（灌肠剂）

122. 酚酞 Phenolphthalein（口服常释剂型）

123. 蒙脱石 Smectite（口服散剂）

（五）肝胆疾病用药

124. 熊去氧胆酸 Ursodeoxycholic Acid（口服常释剂型）

125. 联苯双酯 Bifendate（口服常释剂型、滴丸剂）

（六）其他

126. 小檗碱（黄连素）Berberine(口服常释剂型）

十、泌尿系统用药

（一）利尿药

127. 呋塞米 Furosemide（口服常释剂型、注射剂）

128. 氢氯噻嗪 Hydrochlorothiazide（口服常释剂型）

129. 螺内酯 Spironolactone（口服常释剂型）

130. 氨苯蝶啶 Triamterene（口服常释剂型）

（二）良性前列腺增生用药

131. 特拉唑嗪 Terazosin（口服常释剂型）

十一、血液系统用药

（一）抗贫血药

132. 硫酸亚铁 Ferrous Sulfate（口服常释剂型、口服缓释剂型）

133. 右旋糖酐铁 Iron Dextran（注射剂）

134. 维生素 B_{12} VitaminB_{12}(注射剂）

135. 叶酸 Folic Acid(口服常释剂型）

（二）抗血小板药

•（48）阿司匹林 Aspirin（口服常释剂型）

136. 双嘧达莫 Dipyridamole（口服常释剂型）

（三）促凝血药

137. 凝血酶 Thrombin(外用冻干粉）

138. 维生素 K_1 VitaminK_1(注射剂）

139. 氨甲苯酸 Aminomethylbenzoic Acid（口服常释剂型）

（四）抗凝血药及溶栓药

140. 肝素 Heparin（注射剂）

（五）血容量扩充剂

141. 右旋糖酐(40,70) Dextran (40,70)（注射剂）

十二、激素及影响内分泌药

（一）下丘脑垂体激素及其类似物

142. 绒促性素 Chorionic Gonadotrophin（注射剂）

（二）肾上腺皮质激素类药

143. 氢化可的松 Hydrocortisone(口服常释剂型、注射剂）

144. 泼尼松 Prednisone（口服常释剂型）

145. 地塞米松 Dexamethasone（口服常释剂型、注射剂）

（三）胰岛素及口服降血糖药

胰岛素

146. 胰岛素 Insulin（注射剂）[注释4]

口服降血糖药

147. 二甲双胍 Metformin（口服常释剂型）

148. 格列本脲 Glibenclamide（口服常释剂型）

149. 格列吡嗪 Glipizide（口服常释剂型）

（四）甲状腺激素及抗甲状腺药

150. 甲状腺片 ThyroidTablets（口服常释剂型）

151. 甲巯咪唑 Thiamazole（口服常释剂型）

152. 丙硫氧嘧啶 Propylthiouracil(口服常释剂型）

（五）雄激素及同化激素

153. 丙酸睾酮 Testosterone Pro-

pionate（注射剂）

154. 甲睾酮 Methyltestosterone（口服常释剂型）

（六）雌激素及孕激素

155. 黄体酮 Progesterone（注射剂）

156. 甲羟孕酮 Medroxyprogesterone（口服常释剂型）

十三、抗变态反应药

157. 氯苯那敏 Chlorphenamine（口服常释剂型）

158. 苯海拉明 Diphenhydramine（口服常释剂型、注射剂）

159. 赛庚啶 Cyproheptadine（口服常释剂型）

160. 异丙嗪 Promethazine（口服常释剂型、注射剂）

十四、免疫系统用药

161. 雷公藤多苷 Tripterygium Glycosides（口服常释剂型）

162. 硫唑嘌呤 Azathioprine（口服常释剂型）

十五、维生素、矿物质类药

（一）维生素

163. 维生素 B_1 VitaminB_1（注射剂）

164. 维生素 B_2 VitaminB_2（口服常释剂型）

165. 维生素 B_6 VitaminB_6（注射剂）

166. 维生素 C VitaminC（注射剂）

167. 维生素 D_2 VitaminD_2（口服常释剂型、注射剂）

（二）矿物质

168. 葡萄糖酸钙 CalciumGluconate（口服常释剂型、注射剂）

（三）肠外营养药

169. 复方氨基酸 18AA Compound Amino Acid 18AA（注射剂）

十六、调节水、电解质及酸碱平衡药

（一）水、电解质平衡调节药

170. 口服补液盐 OralRehydration Salts（口服散剂）

171. 氯化钠 Sodium Chloride（注射剂）

172. 葡萄糖氯化钠 Glucoseand Sodium Chloride（注射剂）

173. 复方氯化钠 Compound Sodium Chloride（注射剂）

174. 氯化钾 Potassium Chloride（口服常释剂型、口服缓释剂型、颗粒剂、注射剂）

（二）酸碱平衡调节药

175. 乳酸钠林格 Sodium Lactate Ringer's（注射剂）

176. 碳酸氢钠 Sodium Bicarbonate（口服常释剂型、注射剂）

（三）其他

177. 葡萄糖 Glucose（注射剂）

十七、解毒药

（一）氰化物中毒解毒药

178. 硫代硫酸钠 Sodium Thiosulfate（注射剂）

（二）有机磷酸酯类中毒解毒药

179. 氯解磷定 Pralidoxime Chloride（注射剂）

（三）亚硝酸盐中毒解毒药

180. 亚甲蓝 Methylthioninium Chloride（注射剂）

（四）阿片类中毒解毒药

181. 纳洛酮 Naloxone（注射剂）

（五）鼠药解毒药

182. 乙酰胺 Acetamide（注射剂）

十八、生物制品

183. 破伤风抗毒素 Tetanus Antitoxin（注射剂）

184. 抗狂犬病血清 Rabies Antiserum（注射剂）

185. 抗蛇毒血清 Snake Antivenin（注射剂）[注释5]

186. 国家免疫规划用疫苗[注释6]

十九、诊断用药

187. 泛影葡胺 Meglumine Diatrizoate（注射剂）

188. 硫酸钡 Barium Sulfate（干混悬剂）[注释7]

二十、皮肤科用药

（一）抗感染药

*（13）红霉素 Erythromycin（外用软膏剂型）

*（31）阿昔洛韦 Aciclovir（外用软膏剂型）

189. 咪康唑 Miconazole（外用软膏剂型）

（二）角质溶解药

190. 尿素 Urea（外用软膏剂型）

191. 鱼石脂 Ichthammol（外用软膏剂型）

192. 水杨酸 Salicylic Acid（外用软膏剂型）

（三）肾上腺皮质激素类药

*（143）氢化可的松 Hydrocortisone（外用软膏剂型）

（四）其他

193. 维 A 酸 Tretinoin（外用软膏剂型、凝胶剂）

二十一、眼科用药

（一）抗感染药

194. 氯霉素 Chloramphenicol（滴眼剂）

*（20）左氧氟沙星 Levofloxacin（滴眼剂）

*（31）阿昔洛韦 Aciclovir（滴眼剂）

*（13）红霉素 Erythromycin（眼膏剂）

（二）青光眼用药

195. 毛果芸香碱Pilocarpine(注射剂、滴眼剂)

196. 噻吗洛尔 Timolol（滴眼剂）

197. 乙酰唑胺 Acetazolamide（口服常释剂型）

（三）其他

*（118）阿托品 Atropine（滴眼剂、眼膏剂）

198. 可的松 Cortisone（滴眼剂、眼膏剂）

二十二、耳鼻喉科用药

199. 麻黄碱 Ephedrine（滴鼻剂）

200. 氧氟沙星 Ofloxacin（滴耳剂）

201. 地芬尼多 Difenidol（口服常释剂型）

二十三、妇产科用药

（一）子宫收缩药

202. 缩宫素 Oxytocin（注射剂）

203. 麦角新碱Ergometrine(注射剂)

204. 垂体后叶注射液Posterior Pituitary Injection（注射剂）

（二）其他

*（189）咪康唑 Miconazole （栓剂）

*（37）甲硝唑 Metronidazole（阴道泡腾片剂、栓剂）

二十四、计划生育用药

205. 避孕药（注释8）

除标有“注释”的药品外，化学药品与生物制品按药品品种编号，不同剂型同一化学成分或处方的编一个号，重复出现时标注“*”药品编号的先后次序无特别的涵义。

注释1：目录第9号“头孢呋辛”包括头孢呋辛酯。

注释2：目录第33号“抗艾滋病用药”是指国家免费治疗艾滋病的药品。

注释3：目录第36号“青蒿素类药物”是指卫生部办公厅印发的《抗疟药使用原则和用药方案（修订稿）》中所列的以青蒿素类药物为基础的复方制剂、联合用药的药物和青蒿素类药物注射剂。

注释4：目录第146号“胰岛素”是指动物源胰岛素，包括短效、中效、长效及预混胰岛素。

注释5：目录第185号“抗蛇毒血清”包括抗蝮蛇毒血清、抗五步蛇毒血清、抗银环蛇毒血清、抗眼镜蛇毒血清。

注释6：目录第186号“国家免疫规划用疫苗”是指纳入国家免疫规划的疫苗。

注释7：目录第188号“硫酸钡”包括Ⅰ型、Ⅱ型。

注释8：目录第205号“避孕药”是指纳入中华人民共和国人口和计划生育委员会印发的《计划生育避孕药具政府采购目录》中的避孕药。

附录 4 常用药物的皮肤敏感试验

有些药品如抗生素中 β-内酰胺类的青霉素、头孢菌素；氨基糖苷类抗生素的链霉素、庆大霉素，维生素、有机碘造影剂、局麻药、免疫调节剂、生物药品（酶、抗毒素、类毒素、血清、菌苗、疫苗）等药品在给药后极易引起过敏反应，甚至出现过敏性休克。为安全起见，需在注射给药前进行皮肤敏感试验，皮试后观察 15 ~ 20 分钟，以确定阳性或阴性反应。

对青霉素、头孢菌素、破伤风抗毒素等易致过敏反应的药品，注意提示患者在用药前（或治疗结束后再次应用时）进行皮肤敏感试验，在明确药品敏感试验结果为阴性后，再调配药品；对尚未进行皮试者、结果阳性或结果未明确者拒绝调配药品，同时注意提示有家族过敏史或既往有药品过敏史者在应用时提高警惕性，于注射后休息和观察 30 分钟，或采用脱敏方法给药。

鉴于头孢菌素类抗生素可引起过敏性反应或过敏性休克，同时与青霉素类抗生素存在有交叉过敏性，概率在 3%～15%，但目前头孢菌素应用前是否做皮肤试验的临床意义尚有极大争议，《中华人民共和国药典临床用药须知》（2005 年版）等相关著作尚无定论。国外文献证实：若患者以前发生过青霉素过敏性休克者，应禁用头孢菌素，若过敏反应轻微，必要时可在严密监护下，给予头孢菌素类抗生素。但近年来有多例报道，头孢菌素可致过敏性休克甚至死亡，为慎重起见和对患者的安全用药负责，建议在应用前做皮肤试验，并提示应用所注射的药品品种进行皮试。另外，具体到药物是否需要做药物皮肤敏感试验，请参照药品说明书和官方的药物治疗指南。鉴于各药品生产企业的产品标准不同而对皮肤试验的要求不一，在用药前宜仔细阅读药品说明书。《中国人民共和国药典临床用药须知》（2005 年版）中必须做皮肤敏感试验的药物情况，见附表 4-1。

此外，在部分权威性较高的二次文献中，对部分常用药品也记载应做皮肤敏感试验，在此也列附表 4-2 提示。

附表 4-1 常用药物皮肤敏感试验的药液浓度和给药方法与剂量

药物名称	皮试药液浓度(ml)	给药方法与剂量
细胞色素 C 注射剂	0.03 mg（皮内注射），注射液原液（划痕）5 mg（滴眼）	皮内注射 0.03 ~ 0.05 ml，划痕 1 滴；滴眼 1 滴
降纤酶注射剂	0.1 BU	皮内注射 0.1 ml
门冬酰胺酶注射剂	20 U	皮内注射 0.02 ml
青霉素钾注射剂	500 U	皮内注射 0.1 ml
青霉素钠注射剂	500 U	皮内注射 0.1 ml；划痕 1 滴
青霉素 V 钾片	500 U	皮内注射 0.1 ml
普鲁卡因青霉素注射剂 - 青霉素	500 U	皮内注射 0.1 ml
普鲁卡因青霉素注射剂 - 普鲁卡因	2.5 mg	皮内注射 0.1 ml
苄星青霉素注射剂	500 U	皮内注射 0.1 ml
抑肽酶注射剂	2 500 kU	静脉注射 1 ml
胸腺素注射剂	25 μg	皮内注射 0.1 ml
白喉抗毒素注射剂	稀释 20 倍	皮内注射 0.1 ml
破伤风抗毒素注射剂	75 U（稀释 20 倍）	皮内注射 0.1 ml

（续　表）

药物名称	皮试药液浓度(ml)	给药方法与剂量
多价气性坏疽抗毒素注射剂	250 U（稀释 20 倍）	皮内注射 0.1 ml
抗蛇毒血清注射剂	稀释 20 倍	皮内注射 0.1 ml
抗炭疽血清注射剂	稀释 20 倍	皮内注射 0.1 ml
抗狂犬病血清注射剂	20 U（稀释 20 倍）	皮内注射 0.1 ml
肉毒抗毒素注射剂	稀释 10 倍	皮内注射 0.05 ml
玻璃酸酶注射剂	150 U	皮内注射 0.02 ml
α－糜蛋白酶注射剂	500 μg	皮内注射 0.1 ml
鱼肝油酸钠注射剂	1 mg	皮内注射 0.1～0.2 ml

苯唑西林钠、氯唑西林钠、氨苄西林钠、阿莫西林、羧苄西林钠、哌拉西林钠、磺苄西林钠注射剂和青霉胺片剂等皮试药液浓度和给药剂量同青霉素

附表 4-2　部分提示应做皮肤敏感试验药物的药液浓度和给药方法与剂量

药物名称	皮试药液浓度(ml)	给药方法与剂量
链霉素注射剂	1 mg	皮内注射 0.1 ml
头孢菌素类注射剂	300 μg 或 500 μg	皮内注射 0.1ml
庆大霉素注射剂	400 U	皮内注射 20 ～ 40 U；儿童 5 ～ 10 U
甲氧西林钠注射剂	250 μg	皮内注射 0.1 ml
氯唑西林钠注射剂	250 μg	皮内注射 0.1 ml
苯唑西林钠注射剂	500 μg	皮内注射 0.1 ml
萘夫西林钠注射剂	250 μg	皮内注射 0.1 ml
氨氯西林钠注射剂	250 μg	皮内注射 0.1 ml
氟氯西林钠注射剂	500 μg	皮内注射 0.1 ml
磷酸组胺注射剂	0.1 mg	皮内注射 0.1 ml
右旋糖酐注射剂	原液	皮内注射 0.1 ml
维生素 B_1 注射剂	5 mg	皮内注射 0.1 ml
普鲁卡因注射剂	2.5 mg	皮内注射 0.1 ml
促皮质素注射剂	1 U	皮内注射 0.1 ml
绒促性素注射剂	500 U	皮内注射 0.1 ml
胰蛋白酶	0.5 mg	皮内注射 0.1 ml
胸腺 5 肽	0.1 mg	皮内注射 0.1 ml
胸腺表 α_1	1.6 mg	皮内注射 0.05 ～ 0.1 ml
胸腺素生成素	0.1 mg	皮内注射 0.1 ml(0.01 mg)
甘露聚糖肽	2.5 mg	皮内注射 0.1 ml
蕲蛇酶	0.75 U	皮内注射 0.1 ml
鲑降钙素注射剂	10 U	皮内注射 0.1 ml
天花粉蛋白	0.5 μg	皮内注射 0.1 ml
有机碘造影剂	30% 溶液	静脉注射 1 ml；皮内注射 0.1 ml

①凡头孢菌素规格（每瓶）为 0.5、0.75、1 g 的先依次应用 0.9% 氯化钠注射液 10、15、20 ml 稀释原药后，抽取 0.1 ml，再用 0.9% 氯化钠注射液稀释至 10 ml，抽取 0.1 ml 做皮试。规格为 1.5 g、2 g 的依次用 0.9% 氯化钠注射液 15 ml、20 ml 稀释原药后，抽取 0.05 ml，再用 0.9% 氯化钠注射液稀释至 10 ml，抽取 0.05 ml 做皮试。②若皮试为阳性反应，可采取脱敏治疗给药；* 有机碘造影在应用中仍可出现过敏反应，尚需注意

附录5 静脉给药注意事项

附5.1 静脉输注药品的一般原则

(1) 由于静脉注射给药起效迅速、作用强并且难以逆转，可能会给患者带来较大的风险，因此，应该遵循能够口服给药就不要注射给药的原则。

(2) 只有当患者的疾病状况不宜口服药品，或者疾病的治疗需要持续、恒定的血药浓度时，才可以采用静脉输注的方式给药。

(3) 一般而言，静脉输液中只能加入一种药品，溶液必须稳定，无物理和化学的配伍禁忌。如果需要加入两种药品，应该先加浓度较高者到输液中，充分混匀后，检查有无可见的配伍禁忌，再加入浓度较低的药品。

(4) 不应该将药品加入到血液制品、甘露醇或者碳酸氢钠溶液中。只有特殊组分的药品（如脂溶性维生素注射液）方可加入脂肪乳或氨基酸溶液中使用。

(5) 应用输液前应充分振摇混匀，并且检查有无不溶性颗粒。

(6) 给药期间应严格保证药液无菌，配制好的药液通常应在24小时内使用。

(7) 输液瓶上应注明患者的姓名、药品名称与剂量、给药日期与给药时间以及停药日期与停药时间。以上内容不应影响患者阅读输液瓶上的标签内容。尽可能将使用过的输液器材保存一段时间备查。

(8) 在给药过程中应经常检查药液的状态，当出现浑浊、结晶、颜色改变或观测到其他发生相互作用或污染的迹象时，应及时停药。

附5.2 静脉输液容易产生的问题

附5.2.1 病原微生物污染

静脉输液有可能被偶然进入或后期滋生的微生物污染，尤其是念珠菌属、肠杆菌属及克雷伯杆菌属等而引起发热、寒战等全身性反应，严重者可发生昏迷、血压下降、休克和呼吸衰竭等症状而致死亡。静脉输液应该严格执行配制过程的无菌操作。

附5.2.2 物理和化学配伍禁忌

物理配伍禁忌是指药物混合后，由于溶解度的变化，溶液pH的改变等，或者药物与容器间发生反应等原因引起的沉淀、浑浊、黏度变化、液体分层等现象，又称为外观配伍禁忌。化学配伍禁忌是指药物之间水解、光解、氧化还原等化学反应导致药物分子结构发生了变化。因而导致药物有可能发生药物相互作用，并且当含有一种以上药物时发生配伍禁忌的可能性增大。物理或化学的配伍禁忌会使药效降低、毒性增加或由于微粒的形成产生严重不良事件，因而必须避免。

附5.2.3 微粒污染

微粒污染是输液中普遍存在的问题。静脉输液的配制过程中，多次加药和穿刺会带入微粒，输液环境中的细小微粒也可能进入药液。当微粒进入肺微血管，可引起巨噬细胞增生而导致肉芽肿、肺栓塞，也可引起热原样反应。微粒较大者，可直接导致血管闭塞，局部组织缺血和水肿；红细胞聚集在异物上可形成血栓；某些微粒还可引起变态反应。生物制品，尤其是血液制品，即使是正常配制操作也可能不完全溶解；输液配制过程稍有不慎，如振摇、消毒、温度等均可导致药物不能完全溶解，产生肉眼可见或难以观察的不溶性物质。因此，从配制到输液必须严格遵守操作规程。

附5.3 静脉输液相关的不良反应

附5.3.1 静脉炎

某些晶体溶液，可致血栓性静脉炎。

另外，静脉滴注红霉素乳糖酸盐、万古霉素、依替米星等药物，如果输液配制浓度或输液速度不当也可刺激血管而导致静脉炎。

附 5.3.2 胃肠道反应

静脉滴注某些抗感染药物，如喹诺酮类、青霉素、红霉素等会不同程度地引起恶心、呕吐等胃肠道反应。

附 5.3.3 神经系统反应

青霉素类药物静滴给药时，由于剂量过大和（或）滴速过快时，可对大脑皮质产生直接刺激作用，出现“青霉素脑病”，主要表现为肌阵挛、惊厥、癫痫、昏迷等严重反应。氨基糖苷类、多黏菌素类静脉滴注速度过快对神经肌肉接头可产生阻滞作用。亚胺培南滴注速度过快使脑内血药浓度过高可出现的惊厥、癫痫发作等。喹诺酮类药物脂溶性高，易透过血脑屏障进入脑组织，诱发惊厥、抽搐和癫痫样发作。

附 5.3.4 心血管系统反应

青霉素大剂量快速静滴偶可引起一过性心电图变化。咪康唑注射过快可发生心律失常，严重者心跳、呼吸停止。万古霉素静脉滴注速度过快也可引起心血管系统反应，曾有报道静滴万古霉素过快，引起心搏骤停、呼吸衰竭死亡。氨基糖苷类抗生素也可引起心肌抑制、外周血管扩张、血压下降和呼吸衰竭等。两性霉素 B 滴速过快有引起心室颤动或心搏骤停的可能。林可霉素滴速过快可引起血压下降和心电图变化，甚至可导致神经肌肉接头传导阻滞而引起呼吸、心搏停止。

附 5.3.5 肾功能损害

低分子和小分子量右旋糖酐有导致急性肾衰竭的危险。氨基糖苷类抗生素和万古霉素等药物，如果静脉输注过快，使单位时间内经肾脏排泄的药物浓度过高，可致药物性肾损害。大多数头孢菌素类药物主要通过肾脏排泄，可抑制、干扰肾小管细胞酶活性，引起急性肾小管坏死。而这类现象在小儿、老年人及肾功能不全的患者身上尤易发生。抗病毒药物阿昔洛韦、更昔洛韦、利巴韦林、阿糖腺苷、膦甲酸钠等静脉滴注也宜缓慢。阿昔洛韦静脉滴注过快可发生肾小管内药物结晶沉积，引起肾功能的损害。在使用两性霉素 B 疗程中几乎所有患者均可出现不同程度的肾功能损害，故应注意选择适当剂量，缓慢静滴，必要时监测肾功能和血药浓度。

附 5.3.6 其他不良反应及对策

所有药物静脉输液滴注过快均可引起血容量过高，致心脏负荷过重，发生肺水肿。静脉滴注含钾、钙、镁等离子的抗菌药物时，滴速过快可引起患者不适或病情变化。右旋糖酐、明胶制剂和羟乙基淀粉等胶体溶液的常见不良反应有凝血功能障碍、肾功能障碍、过敏和类过敏反应等。

附 5.3.6.1 局部封闭

化疗药物外渗，应用局部封闭，可阻止化疗药物扩散并起到止痛、消炎的作用。临床上多用普鲁卡因、地塞米松局部封闭，因普鲁卡因有麻醉止痛、减少炎症渗出和促进组织修复的作用；地塞米松具有稳定生物膜，减少炎性物质释放，提高组织耐受性和特异性抗炎作用。

附 5.3.6.2 局部使用血管扩张药物

在输入刺激性大、浓度高的药物时，使用 2% 的山莨菪碱外敷局部静脉，扩张局部浅表血管后再给药，减轻药物对血管的刺激。

附 5.3.6.3 静脉渗漏性损伤及其处理

静脉渗漏性损伤的诸多因素中主要的是药物本身的理化性质。有效的预防措施可积极消除引起渗漏的危险因素，如提高静脉穿刺技术，避免机械性损伤、根据不同药物掌握好其浓度和静脉输注速度、加强护理观察，尽量避免药物外漏。对已发生渗漏损伤者，应及时根据药物理化性质，渗漏损伤程度及个体差异，适当选择热敷、冷敷、药敷或拮抗药注射等处理，若能早期治疗完全可以避免严重并发症的发生。

静脉注射液外渗的处理

（1）一旦发生静脉注射液外渗，应立即停止注射或更换注射部位，并且采取治

疗措施，消除组织水肿，消除药物对细胞的毒性作用。

（2）热敷：主要用于血管收缩药、阳离子溶液、高渗液及化疗药物外渗的治疗。如肾上腺素、间羟胺、葡萄糖酸钙、甘露醇等溶液的外渗治疗。但是，部分高渗溶液，如20%甘露醇、10%葡萄糖酸钙外渗超过24小时，此时局部皮肤由白转为暗红，产生局部充血，若局部进行热敷使温度增高、代谢加快、耗氧增加，会加速组织坏死。因此，必须根据具体情况采取相应措施，不应该不加思考地只要是药物外渗就给病人热敷。

（3）冷敷：冷敷可使局部血管收缩，减少药物的吸收，减轻局部水肿和药物的扩散，从而减轻局部组织的损害，如化疗药物外渗用20%～40%碳酸氢钠冷敷治疗，取得较好的效果。

（4）药物湿敷：采用50%的硫酸镁溶液湿敷，一日2次，一次20分钟。

（5）中药湿敷：主要用于长期静脉注射的药物，如氯化钾、红霉素、10%葡萄糖酸钙等致注射部位的静脉壁炎性渗出而引起的炎症症状，可以采取活血通络、舒筋利脉、温经散寒、清热利湿的中药进行湿敷。

附录 6　特殊药品目录

麻醉药品、精神药品、医疗用毒性药品、放射性药品属于特殊管理药品的范畴。

附 6.1　医疗用毒性药品

医疗用毒性药品系指毒性剧烈、治疗剂量与中毒剂量相近，使用不当会致人中毒或死亡的药品。

毒性中药品种（包括原药材和饮片）主要有：砒石（红砒、白砒）、砒霜、水银、生马前子、生川乌、生草乌、生白附子、生附子、生半夏、生南星、生巴豆、斑蝥、青娘虫、红娘虫、生甘遂、生狼毒、生藤黄、生千金子、生天仙子、闹羊花、雪上一枝蒿、白降丹、蟾酥、洋金花、红粉、轻粉、雄黄。

毒药化学药品种（仅指原料药，不包括制剂）主要有：去乙酰毛花苷 C、阿托品、洋地黄毒苷、氢溴酸后马托品、三氧化二砷、毛果芸香碱、升汞、水杨酸毒扁豆碱、亚砷酸钾、氢溴酸东莨菪碱、士的宁、A 型肉毒素。毒药化学药品种（制剂）亚砷酸注射液。

毒性药品的收购、经营，由各级医药管理部门指定的药品经营单位负责；配方用药由国营药店、医疗单位负责。其他任何单位或者个人均不得从事毒性药品的收购、经营和配方业务。

附 6.2　放射性药品

放射性药品是指用于临床诊断或者治疗的放射性核素制剂或者其标记药物。

附 6.3　麻醉药品

麻醉药品是指连续使用后易产生生理依赖性、能成瘾癖的药品；麻醉药品包括：阿片类、可卡因类、大麻类、合成麻醉药类及卫生部指定的其他易成瘾癖的药品、药用原植物及其制剂。

我国生产及使用的麻醉药品品种包括吗啡、芬太尼、氯胺酮、二氢埃托啡、可卡因、罂粟秆浓缩物、哌替啶、地芬诺酯、美沙酮、羟考酮、阿片、罂粟壳、舒芬太尼、瑞芬太尼、蒂巴因、可待因、布桂嗪、右丙氧芬、双氢可待因、复方樟脑酊、乙基吗啡、福尔可定等，详见附表 6-1。

附表 6-1　我国生产及使用的麻醉药品品种目录△

阿法罗定	Alphaprodine
可卡因	Cocaine
罂粟秆浓缩物	Concentrate of Poppy Straw
二氢埃托啡	Dihydroetorphine
地芬诺酯	Diphenoxylate
芬太尼	Fentanyl
氢可酮	Hydrocodone
美沙酮	Methadone
吗啡	Morphine
阿片	Opium
羟考酮	Oxycodone

（续 表）

哌替啶	Pethidine
罂粟壳	Poppy Shell
瑞芬太尼	Remifentanil
舒芬太尼	Sufentanil
蒂巴因	Thebaine
布桂嗪	Bucinnazine
可待因	Codeine
复方樟脑酊	Compound Camphor Tincture
右丙氧芬	Dextropropoxyphene
双氢可待因	Dihydrocodeine
乙基吗啡	Ethylmorphine
福尔可定	Pholcodine
阿桔片	Compound Platycodon Tablets
吗啡阿托品注射液	Morphine and Atropine Sulfate Injection

①上述品种包括其可能存在的盐和单方制剂；②上述品种包括其可能存在的化学异构体及酯、醚；③△：本目录根据2007版《麻醉品种目录》中摘选其中有*的麻醉药品，均为我国生产及使用的品种

附 6.4 精神药品

精神药品是指直接作用于中枢神经系统，使之兴奋或抑制，连续使用能产生依赖性的药品。依据精神药品使人体产生的依赖性和危害人体健康的程序，分为第一类和第二类，各类精神药品的品种由国务院药品监督管理部门会同国务院公安部门、国务院卫生部门制定、调整并公布。我国生产及使用的精神药品品种目录见附表6-2。

我国生产及使用的第一类精神药品品种有：丁丙诺啡、γ-羟丁酸、马吲哚、哌甲酯、司可巴比妥、三唑仑等。

我国生产及使用的第二类精神药品品种有：异戊巴比妥、布托啡诺及其注射剂、咖啡因、去甲伪麻黄碱、安钠咖、地佐辛及其注射剂、喷他佐辛、阿普唑仑、巴比妥、氯氮䓬、地西泮、艾司唑仑、氟西泮、劳拉西泮、甲丙氨酯、咪达唑仑、纳布啡及其注射剂、硝西泮、匹莫林、苯巴比妥、曲马朵、唑吡坦、扎来普隆、麦角胺咖啡因等。

附 6.5 易制毒化学品

易制毒化学品系指可利用其制备毒品的化合物，分为3类。第一类是可以用于制毒的主要原料，第二类、第三类是可以用于制毒的化学配剂。

第一类：①1-苯基-2-丙酮；②3,4-亚甲基二氧苯基-2-丙酮；③胡椒醛；④黄樟素；⑤黄樟油；⑥异黄樟素；⑦N-乙酰邻氨基苯酸；⑧邻氨基苯甲酸；⑨麦角酸*；⑩麦角胺*、⑪麦角新碱*；⑫麻黄碱、伪麻黄碱、消旋麻黄碱、去甲麻黄碱、甲基麻黄碱、麻黄浸膏、麻黄浸膏粉等麻黄素类物质*。（带有*标记的品种为药品类易制毒化学品，包括原料药及其单方制剂）。

第二类：①苯乙酸；②醋酸酐；③三氯甲烷；④乙醚；⑤哌啶。

第三类：①甲苯；②丙酮；③甲基乙基酮；④高锰酸钾；⑤硫酸；⑥盐酸。

第一类、第二类所列物质可能存在的盐类，也纳入管制。

附表 6-2 我国生产及使用的精神药品品种目录△

第一类	
丁丙诺啡	Buprenorphine
γ-羟丁酸	γ-hydroxybutyrate (GHB)
氯胺酮	Ketamine
马吲哚	Mazindol
哌醋甲酯	Methylphenidate
司可巴比妥	Secobarbital
三唑仑	Triazolam
第二类	
异戊巴比妥	Amobarbital
布托啡诺及其注射剂	Butorphanol and its injection
咖啡因	Caffeine
安钠咖	Caffeine Sodium Benzoate (CNB)
去甲伪麻黄碱	Cathine
地佐辛及其注射剂	Dezocine and its injection
芬氟拉明	Fenfluramine
格鲁米特	Glutethimide
喷他佐辛	Pentazocine
戊巴比妥	Pentobarbital
阿普唑仑	Alprazolam
巴比妥	Barbital
溴西泮	Bromazepam
氯氮䓬	Chlordiazepoxide
氯硝西泮	Clonazepam
地西泮	Diazepam
艾司唑仑	Estazolam
氯氟䓬乙酯	Ethyl Loflazepate
氟西泮	Flurazepam
劳拉西泮	Lorazepam
甲丙氨酯	Meprobamate
咪达唑仑	Midazolam
纳布啡及其注射剂	Nalbuphine and its Injection
硝西泮	Nitrazepam
奥沙西泮	Oxazepam
氨酚氢可酮片	Paracetamol and Hydrocodone Bitartrate Tablets
匹莫林	Pemoline
苯巴比妥	Phenobarbital
替马西泮	Temazepam
曲马多	Tramadol
唑吡坦	Zolpiden
扎来普隆	Zaleplone
麦角胺咖啡因片	Ergotamine and Caffeine Tablets

①上述品种包括其可能存在的盐和单方制剂（除非另有规定）；②上述品种包括其可能存在的化学异构体及酯、醚（除非另有规定）；③△：本目录根据 2007 版《精神药品品种目录》中摘选其有·的精神药品，均为我国生产及使用的品种

附录7 部分监测药物的药动学参数

详见附表7-1。

附表7-1 部分监测药物的药动学参数

药品名称	口服生物利用度(%)	达峰时间（小时）	血浆蛋白结合率(%)	表观分布容积(L/kg)	消除半衰期（小时）	消除途径	达稳态时间（日）	清除率(ml/kg)	有效浓度范围(mg/L)	潜在中毒浓度(mg/L)	剂量(mg/kg)
卡马西平	75～85	4～8	75～80	0.8～2.2	25～65	肝99%	7～14	成人一日11～26 儿童一日28	4～12	＞12	成人一日7～19，分次 儿童一日10～20，分次
乙琥胺	～100	成人2～4 儿童3～7	＜10	0.65	成人50～60 儿童30～36	肝70% 肾30%	成人8～12 儿童6～10	成人一日10～13 儿童一日16	40～100	＞150	成人一日15～30 儿童一日15～40
苯巴比妥	80～90	2～18	20～45	成人0.7 儿童0.9	成人50～144 儿童40～70	肝80% 肾20%	成人14～21 儿童10～18	成人一日3.2 儿童一日8.2	10～40	＞40	成人一日1～5，分次 儿童一日3～6，分次

（续　表）

药品名称	口服生物利用度(%)	达峰时间（小时）	血浆蛋白结合率(%)	表观分布容积(L/kg)	消除半衰期（小时）	消除途径	达稳态时间（日）	清除率(ml/kg)	有效浓度范围(mg/L)	潜在中毒浓度(mg/L)	剂量(mg/kg)
苯妥英	95	4～12	85～95	0.5～0.8	7～42	肝＞95% 肾＜5%	成人 5～14 儿童 2～5		10～20	＞25	负荷量一日15， 维持量一日5（成人）
扑米酮	92	成人 2.7～5.2 儿童 4～6	0～20	0.64～0.72	10	肝、肾	2～4	一日31（单用）	6～15	＞18	成人一日7.5～20，分次 儿童一日5～25，分次
丙戊酸	～100	空腹 0.5～1.5 食后 2～8	85～95	0.1～0.4	成人12～15 老年14～17 新生儿 30～40	肝	2～2.5	成人每小时 7～8	50～100	未定	成人一日5～45，分次 儿童一日15～60，分次
丙吡胺	90	1～3	35～95	3～5.7	4～10	肝～25% 肾～50%	成人 25～30小时	一日1.5～4	2～4	＞7	负荷量一次300 mg， 维持量一日400～800 mg
奎尼丁	44～98	1～3	80～88	2～3	成人6～8 儿童 2.5～6.7	肝主要 肾少量	2	一日4.70	3～6	＞5	一日14～30，分次
普萘洛尔	30	1～1.5	93	2.0～4.6	2～3	肝95%	10～30小时	每分钟12	0.05～0.1	未定	负荷量一次300 mg， 维持量一日400～800 mg
利多卡因	35	不规则	66	1	1～2 （心力衰竭 1.9～6）	肝	5～10小时	一日0.54～1.44	1.5～5	＞5.0	负荷量一次100～150 mg， 维持量每分钟0.9～1.8 mg

（续 表）

药品名称	口服生物利用度(%)	达峰时间（小时）	血浆蛋白结合率(%)	表观分布容积(L/kg)	消除半衰期（小时）	消除途径	达稳态时间（日）	清除率(ml/kg)	有效浓度范围(mg/L)	潜在中毒浓度(mg/L)	剂量(mg/kg)
普鲁卡因胺	75～95	1～1.5	15～20	1.75～2.5	2～3	肝肾	11～20小时	每小时(8.6±1.9)	2～10	＞16	负荷量一次10～15，维持量35～50 mg
地高辛	60～80	2～6	20～25	6～10	32～48	肾	成人7～11	成人188 ml/(min·1.73 m^3)	0.5～2 μg/L	＞2.4 μg/L	负荷量一次8～125 μg/kg，维持量一日3～5 μg/kg
庆大霉素	几不吸收	即刻（注）	0～30	0.2～0.25	成人2～3（肾衰竭40～50）儿童5～11.5	肾	2.5～15小时（＞30岁）	1.33±0.611 9	峰4～10 谷1～2	峰＞12 谷＞2	负荷量一次1.0～2.5，维持量一日3.0～5.0
妥布霉素	几不吸收	即刻（注）	低	0.26	1.9～2.2	肾	约10小时	每小时(75.65±16.88)	峰4～10 谷1～2	峰＞12 谷＞2	一日5～7
万古霉素	几不吸收	即刻（注）	55	0.43～1.25	成人4～11 儿童2～3	肝	3～5	老年人：每分钟(61.05±10.30) ml 成人：每分钟(87.35±9.45) ml	峰25～40 谷5～10	峰＞50 谷＞20	成人一日10～30，分次 儿童一日10～40，分次
阿米替林	56～70	8～12	90	5.4～8.6	9～25	肝	4～10	5.3～26	0.15～0.25	＞0.5	成人一日75～300 mg 老年一日20～100 mg
碳酸锂	97	0.5～3	0	0.4～1.4	20～24（肾衰竭40～50）	肾	2～7	15～30	急性治疗0.8～1.2 mmol/L 维持治疗0.4～0.8 mmol/L	＞1.4 mmol/L	成人一日0.9～1.5 g，分次

（续　表）

药品名称	口服生物利用度(%)	达峰时间（小时）	血浆蛋白结合率(%)	表观分布容积(L/kg)	消除半衰期（小时）	消除途径	达稳态时间（日）	清除率(ml/kg)	有效浓度范围(mg/L)	潜在中毒浓度(mg/L)	剂量(mg/kg)
茶碱	～100	2～3	60	0.3～0.7	成人 4～10.9 儿童 2.6～4.8 新生儿＞24	肝	3～8	每分钟 (0.67±0.13)	＜15	＞15	视制剂不同而定
环孢素	20～30	3～4	90	3.5～4	10～30	肝 94% 肾 6%		每分钟 5～7 ml	骨髓移植：100～200 ng/ml 肝移植：200～300 ng/ml 肾移植：100～200 ng/ml		视移植后时间及移植种类而定
他克莫司 发	10～20	0.7～6	＞98.8	16.1	4～41	肝	3	成年每小时 2.43 L 肝移植：每小时 4.1 L	10～20 ng/ml		视移植后时间及移植种类而定

附录 8 药品使用提示标签

药师在调配药品时，必须在药品的外包装上标记出使用药品的信息，包括剂量、给药次数等。药品使用提示标签是为了提醒患者在药品使用和保存方面应特别重视的问题，内容简单明了，作为医嘱和药品说明书关于用药的重要信息的强化和补充。

根据用药的实际情况，遴选下列 34 个药品使用提示标签，其中黑体字作为提示标签用语，非黑体字作为标签含义、适用范围的解释，见附表 8-1。

标签 [1] ~ [19] 和 [29] ~ [31] 可以作为单独的标签用语；标签 [21] ~ [28] 是可以和用法与用量一起作为标签使用；标签 [32] ~ [34] 是提示药品保管与储存。

药品的使用提示标签序号，见附表 8-2。

附表 8-1 药品使用提示标签用语与说明

[1]	**提示用语：可致困倦** 限含有抗组胺药的儿童制剂。
[2]	**提示用语：可导致困倦或其他症状（如视物模糊、精神不集中、眩晕、恶心），服用期间不要操作机器、高空作业或驾驶，同时禁止饮酒** 有些药品仅在服药的前几天感觉困倦，有些药品仅在大剂量时引起困倦，应该告诉患者症状消失后再进行以上操作。
[3]	**提示用语：可能导致困倦，服用期间不要操作机器、高空作业或驾驶，同时禁止饮酒或含乙醇饮料** 用于含单胺氧化酶抑制药的药品。
[4]	**提示用语：不要饮酒** 服用某些药品时同时饮酒，会增强某些药品的作用和不良反应。
[5]	**提示用语：不要同时服用抗酸药** 用于肠溶衣制剂或受抗酸药显著影响吸收、影响药效的药品。
[6]	**提示用语：不要同时服用含铁、铝、钙、镁、锌等金属离子的药品** 这些药品易与铁、铝、钙、镁、锌等离子螯合，减少吸收。应间隔 2 ~ 3 小时服用。
[7]	**提示用语：不要与牛奶同服的药品** 牛奶可影响部分药品的吸收，应间隔 2 ~ 3 小时服用。
[8]	**提示用语：应遵医嘱，不要随便停药** 适用于长期服用或突然停药会造成严重后果的药品。
[9]	**提示用语：遵照医嘱，完成处方的疗程** 用于需要完成一定疗程的药品，如抗感染药、糖皮质激素等。
[10]	**提示用语：请按照打印说明用药** 某些特殊药品应该给患者治疗卡片说明用药方法，如抗凝药、锂剂和糖皮质激素类等。
[11]	**提示用语：用药后，避免阳光直射** 有些药品可致易感患者的光敏反应，尤其在高强度的紫外灯和阳光下。
[12]	**提示用语：用药期间不要服用含阿司匹林的药品** 阿司匹林可降低某些药品的疗效。
[13]	**提示用语：用水溶解或与水混匀后服用** 用于服前需用水溶解的药品（可溶性片剂）或用前需用水混匀（粉剂，颗粒剂）的药品。

附

录

（续 表）

[14]	**提示用语：可能引起尿液变色** 用于可使尿液变色的药品，包括酚酞致粉红碱性尿，氨苯蝶啶使尿液见光呈蓝色，左旋多巴使尿液变深红色，利福平使尿液呈红色。
[15]	**提示用语：药品易燃，远离火焰** 含易燃的药品要远离明火。
[16]	**提示用语：舌下含化，不要转移包装，注意密封** 提醒患者不要将硝酸甘油片从包装中取出放入塑料袋或其他不合适的器皿内。
[17]	**提示用语：24 小时内服用药品不要超过限量**
[18]	**提示用语：一日内或一周内服用药品不要超过限量**
[19]	**提示用语：可导致困倦并持续较长时间，服用期间不要操作机器、高空作业或驾驶，同时禁止饮酒** 用于镇静、催眠且具有后效应的药品。
[20]	**提示用语：餐后或与食物同服** 避免对胃肠道的刺激、与食物同服吸收更好、增强疗效或减少不良反应的药品。
[21]	**提示用语：餐前 0.5 ~ 1 小时服用** 可促进药品的吸收、发挥疗效、保护胃黏膜、健胃、助消化的药品。
[22]	**提示用语：空腹或餐前 1 小时服用** 有些药品的吸收可被胃内食物和胃酸破坏，减少吸收。
[23]	**提示用语：咀嚼或含服** 用于需要吮吸或咀嚼的制剂。
[24]	**提示用语：需整片吞咽，不要咀嚼或掰碎** 用于包肠溶衣或缓、控释的药品，以及异味刺激或损伤口腔黏膜的药品。
[25]	**提示用语：舌下含化** 用于舌下含化的药品。将药品放于舌下含化，不要吞咽或饮水。有时将药品放在齿龈和颊部之间。
[26]	**提示用语：大量饮水** 需大量水稀释的制剂、促进排泄或需水化治疗的药品。应注意“大量”指的是至少 150 ml。
[27]	**提示用语：稀薄涂敷** 用于外用制剂。
[28]	**提示用语：不宜随意服用，每次或每日剂量须严格限定** 用于解热镇痛药、解痉药等或标示必要时服用的药品。
[29]	**提示用语：不要与其他含对乙酰氨基酚的制剂同时服用** 用于所有含对乙酰氨基酚的药品的外包装上。
[30]	**提示用语：含阿司匹林和对乙酰氨基酚。不要服用其他含相同成分的复方制剂** 用于含阿司匹林和对乙酰氨基酚的所有药品的外包装。
[31]	**提示用语：含阿司匹林** 用于药品名称中没有阿司匹林字样的含阿司匹林的药品。
[32]	**提示用语：避光保存**
[33]	**提示用语：冷处保存（2 ~ 10℃）**
[34]	**提示用语：防潮，密封保存**

附表 8-2 部分药品的使用提示标签

药品名称	推荐药品使用注意提示标签	药品名称	推荐药品使用注意提示标签
阿苯达唑	[9]	苯扎贝特	[20]
阿伐斯汀	[2]	苯扎贝特缓释片	[20] [24]
阿呋唑嗪	[2]	比沙可啶肠溶片	[5] [24]
阿呋唑嗪缓释剂	[2] [20] [24]	比索洛尔	[2] [8]
阿卡波糖	[2] [20]	吡拉西坦	[2]
阿洛西林缓释片	[9] [24]	吡美莫司乳膏	[27]
阿米替林	[2]	吡嗪酰胺	[8] [20]
阿米替林缓释剂	[2] [24]	别嘌醇	[2] [8] [26]
阿莫西林	[9]	丙吡胺缓释片	[24]
阿莫西林干混悬剂	[9] [13] [32]	丙硫异烟胺	[8] [20]
阿莫西林咀嚼片	[9] [23]	丙戊酸钠	[8]
阿普唑仑	[2]	丙戊酸钠肠溶片	[5] [8] [24]
阿奇霉素	[2] [6] [9] [22]	丙戊酸钠缓释片	[8] [24]
阿奇霉素混悬液	[2] [6] [9] [22]	布地奈德吸入剂	[8] [10]
阿司匹林肠溶片	[5] [24] [31] [34]	布洛芬	[2] [20] [32]
阿司匹林分散片	[13] [20] [31] [34]	布洛芬缓释片	[2] [24]
阿司匹林缓释片	[24] [31] [34]	布洛芬颗粒剂	[2] [13] [20]
阿司匹林泡腾片	[13] [20] [31] [34]	茶碱	[20] [32]
阿司匹林栓剂	[31] [32] [34]	茶碱缓释片	[20] [24] [32]
阿替洛尔	[8] [21]	雌二醇	[10]
阿替洛尔缓释片	[8] [21] [24]	雌莫司汀	[5] [22]
阿托伐他汀	[2]	醋酸氢化可的松	[10] [20]
阿昔洛韦	[9]	单硝酸异山梨酯缓释片	[24]
阿昔莫司	[20]	地蒽酚软膏	[27]
埃索美拉唑	[21] [24]	地尔硫䓬缓释片	[24]
氨苯蝶啶	[14] [20]	地塞米松	[10] [20]
氨苯砜	[8]	地西泮	[2] [19]
氨苄西林	[9] [22]	丁螺环酮	[2]
氨茶碱片	[32] [34]	丁酸氢化可的松外用制剂	[27]
胺碘酮	[11]	度洛西汀	[2]
奥氮平	[2]	对氨基水杨酸钠片	[32]
奥卡西平	[3] [8]	对乙酰氨基酚	[29]
奥美拉唑	[2] [5]	多塞平	[2]
奥美拉唑肠溶片	[2] [5] [24]	多沙唑嗪缓释片	[2] [24]
奥沙拉秦	[20]	多沙唑嗪控释片	[2] [24]
奥沙西泮	[2]	多西环素	[6] [9] [11]
奥司他韦	[2] [9]	厄洛替尼	[20]
奥昔布宁	[2] [24]	二甲双胍	[20]
巴氯芬	[2] [8]	二甲双胍缓释片	[20] [24]
倍他米松	[10]	二氯尼特	[9]
倍他米松外用制剂	[27]	二硝酸异山梨酯缓释片	[24]
倍他司汀	[20]	伐昔洛韦	[2] [9]
苯巴比妥	[2] [8]	泛昔洛韦	[9]
苯海索	[2]	非洛地平缓释片	[24]
苯噻啶	[2]	非诺贝特	[2] [20]

（续　表）

药品名称	推荐药品使用注意提示标签	药品名称	推荐药品使用注意提示标签
非索非那定	[2]	卡马西平咀嚼片	[2] [8] [20] [23]
芬太尼贴剂	[2]	卡培他滨	[2] [20]
奋乃静	[2]	卡维地洛	[8]
伏立康唑	[2] [9] [11] [22]	可乐定	[2] [8]
氟比洛芬	[20]	克拉霉素	[2] [9]
氟比洛芬缓释片	[20] [24]	克拉霉素缓释片	[2] [9] [24]
氟伐他汀	[2]	克林霉素	[9]
氟伐他汀缓释片	[2] [24]	喹硫平	[2]
氟奋乃静	[2]	拉贝洛尔	[2] [8]
氟伏沙明	[2]	拉莫三嗪	[2] [8] [11]
氟康唑	[9]	兰索拉唑肠溶片	[5] [24]
氟氯西林	[9] [22]	劳拉西泮	[2] [19]
氟哌啶醇	[2]	乐卡地平	[2] [21]
氟西泮	[19]	雷米普利	[2]
氟西汀	[2]	利巴韦林	[2] [5] [9] [20]
复方甘草片	[34]	利福平	[8] [14] [21] [32]
格列齐特缓释片	[21] [24]	利奈唑胺	[9]
更昔洛韦	[20] [24]	利培酮	[2]
枸橼酸铋雷尼替丁	[2] [21]	利血平	[2]
鬼臼毒素酊剂	[15]	硫酸亚铁片	[34]
桂利嗪	[2]	硫糖铝	[5] [22] [34]
红霉素肠溶片	[5] [9] [24]	硫唑嘌呤	[20]
红霉素颗粒剂	[9] [13]	柳氮磺吡啶肠溶片	[5] [14] [20] [24] [26]
华法林	[10]	氯苯那敏	[2]
环孢素	[2] [10]	氯丙嗪	[2] [11]
环丙沙星	[2] [7] [9] [11]	氯氮平	[2] [10]
环磷酰胺	[22] [26]	氯法齐明	[2] [8] [14] [20]
环丝氨酸	[2] [8]	氯化铵片	[34]
黄酮哌酯	[2] [20]	氯化钾片	[34]
磺胺嘧啶	[9] [26]	氯喹	[2] [5]
吉非贝齐	[21]	氯雷他定	[2]
甲氨蝶呤	[2] [26]	氯马斯汀	[2]
甲氟喹	[2] [20] [24] [26]	氯米帕明	[2]
甲基多巴	[2] [8]	氯米帕明缓释剂	[2] [24]
甲泼尼龙	[10]	氯硝西泮	[2] [8]
甲泼尼龙注射剂	[10]	螺内酯	[20]
甲硝唑片	[2] [4] [9] [20]	吗啡缓释片	[2]
甲氧氯普胺	[2] [24] [32]	吗氯贝胺	[3] [10] [20]
降钙素鼻喷雾剂	[33]	美洛昔康	[20]
金刚烷胺	[2]	美司坦	[5] [21] [24]
金诺芬	[20]	美托洛尔	[8] [20]
卡巴克洛片	[32]	美托洛尔缓释片	[8] [20] [24]
卡马西平	[2] [8]	美西律	[2] [20] [26]
卡马西平缓释片	[2] [8] [24]	孟鲁司特咀嚼片	[2] [22] [23]
卡马西平混悬液	[2] [8]	咪康唑	[9] [20]

（续 表）

药品名称	推荐药品使用注意提示标签	药品名称	推荐药品使用注意提示标签
咪唑斯汀缓释片	[2] [24]	双氯芬酸肠溶／控释片	[2] [5] [21] [24]
米非司酮	[10] [22]	双氯芬酸分散片	[2] [13] [21]
米诺环素	[6] [9]	双嘧达莫	[21]
米诺环素缓释片	[6] [9] [24]	双嘧达莫缓释片	[2] [24]
米索前列醇	[2] [20]	双岐三联活菌胶囊	[33]
莫西沙星	[2] [6] [9] [11]	水杨酸溶液	[15]
奈多罗米钠	[8]	司可巴比妥	[19]
奈非那韦	[20]	司来吉兰	[3]
萘丁美酮	[2] [20]	司他夫定	[9]
萘丁美酮分散片	[2] [13] [20]	四环素	[7] [9] [22]
萘普生	[2] [20]	索拉非尼	[22]
萘普生肠溶片	[2] [5] [24]	索他洛尔	[8]
尼卡地平缓释片	[24]	他克莫司	[2] [11] [22]
诺氟沙星	[2] [7] [9] [11] [22] [26]	他克莫司软膏	[11] [27]
帕罗西汀	[2] [20]	坦洛新缓释片	[20] [24]
哌甲酯缓释片	[24]	碳酸钙咀嚼片	[23]
哌替啶	[2]	碳酸钙颗粒剂、泡腾剂	[13] [34]
哌唑嗪	[2]	碳酸锂	[2] [10]
泮托拉唑肠溶片	[2] [21] [24]	碳酸锂缓释片	[2] [10] [24]
培哚普利	[2] [21]	特拉唑嗪	[2]
泼尼松龙	[10]	替硝唑	[2] [4] [9] [20]
葡萄糖酸钙含片	[23]	酮康唑	[2] [5] [9] [20]
普伐他汀	[2] [20]	酮替芬	[2] [20]
普罗帕酮	[2] [20]	头孢氨苄	[9]
普萘洛尔	[8] [32]	头孢呋辛	[4] [9] [20] [24]
普萘洛尔缓释片	[8] [24] [34]	头孢呋辛粉剂	[4] [9] [13] [20]
齐多夫定口服溶液	[2] [9]	头孢呋辛缓释片	[4] [9] [20] [24]
羟氯喹	[2] [5] [20]	头孢克洛	[4] [9] [22]
羟嗪	[2]	头孢克洛缓释片	[9] [20] [24]
青霉胺	[6] [20]	头孢克肟	[4] [9] [22]
氢化可的松外用制剂	[27]	头孢拉定	[9] [22]
		头孢羟氨苄	[9]
氢化可的松注射剂	[10]	托吡酯	[2] [8]
曲马多	[2] [32]	托特罗定	[2] [11]
曲马多缓释片	[2] [24] [32]	万古霉素	[9]
曲唑酮	[2]	维A酸	[11] [20]
噻吗洛尔	[8] [20]	维拉帕米缓释片	[2] [24]
赛庚啶	[2]	维生素 B_1 片	[32] [34]
三氟拉嗪	[2]	维生素 B_2 片	[32] [34]
色甘酸钠吸入剂	[8]	维生素 B_6 片	[32] [34]
沙美特罗吸入剂	[8]	维生素C片	[32] [34]
舍曲林	[2]	维生素K	[32]
舒必利	[2]	伪麻黄碱	[2]
舒马普坦	[2] [10]	文拉法辛缓释胶囊	[2] [24]
双氯芬酸	[2] [21] [24]	文拉法辛胶囊	[2]

附录

（续　表）

药品名称	推荐药品使用注意提示标签	药品名称	推荐药品使用注意提示标签
西咪替丁	[2] [20]	胰酶	[5] [21] [24] [34]
西酞普兰	[2]	乙胺丁醇	[2] [8] [20]
西替利嗪	[2]	乙醇溶液	[15]
硝苯地平缓释片	[24]	乙酰唑胺	[2]
硝酸甘油	[16]	乙酰唑胺缓释剂	[2] [24]
硝酸甘油缓释片	[24]	异丙嗪	[2]
硝西泮	[19]	异维A酸凝胶	[11] [27]
辛伐他汀	[2] [20]	异烟肼	[2] [3] [8] [21] [32]
熊去氧胆酸	[2] [20]	益康唑乳膏	[27]
亚硝酸异戊酯吸入剂	[33]	吲达帕胺缓释片	[2] [24]
氧氟沙星	[2] [6] [9] [11]	吲哚美辛	[2] [20]
伊马替尼	[20] [26]	茚地那韦	[22] [26]
伊曲康唑胶囊	[5] [9] [20] [24]	扎鲁司特	[22]
依西美坦	[20]	左氧氟沙星	[2] [6] [9] [11]
胰岛素	[33]		

药品名称索引（汉英对照）

B

C

D

E

F

K

索引

O

P

Q

索引

Z

索引

药品名称索引（英汉对照）

D

E

H

I

K

L

M

N

Q

R

S

疾病名称索引

名词缩略语

AASV	ANCA 相关性小血管炎
ABPA	过敏性支气管肺曲霉菌病
ACEI	血管紧张素转换酶抑制药
ACS	急性冠状动脉综合征
AD	阿尔茨海默病
ADCC	抗体依赖性细胞的细胞毒
ADE	药品不良事件
ADHD	注意缺陷多动障碍
ADP	二磷酸腺苷
ADR	药品不良反应
AECB	慢性支炎管炎加重
AI	芳香化酶抑制药
AIDP	急性炎性脱髓鞘性多发性神经病
AIDS	获得性免疫缺陷综合征，艾滋病
AIN	急性间质性肾炎
ALL	急性淋巴细胞白血病
ALT	丙氨酸转氨酶
AMI	急性心肌梗死
AML	急性髓性白血病
ANC	绝对中性粒细胞计数
ANCA	抗中性粒细胞胞浆抗体
APA	醛固酮分泌腺瘤
APTT	激活的部分凝血活酶时间
AR	变态反应性鼻炎
ARB	血管紧张素Ⅱ受体拮抗药
ARDS	急性呼吸窘迫综合征
ARF	急性肾衰竭
AS	强直性脊柱炎
5-ASA	5- 氨基水杨酸
AST	天冬氨酸转氨酶
ATN	急性肾小管坏死
ATRA	全反式维 A 酸
AUC	药 - 时曲线下面积
BPH	良性前列腺增生
BRMs	生物反应调节药
BSA	体表面积
CABG	冠状动脉搭桥术
CCB	钙通道阻滞药
CCr	肌酐清除率
CD	克罗恩病
CIN	慢性间质性肾炎
CK	肌酸激酶
CKD	慢性肾脏疾病
CLL	慢性淋巴细胞白血病
CM	小舞蹈病
C_{max}	血药峰浓度
CML	慢性髓性白血病
CMV	巨细胞病毒
COPD	慢性阻塞性肺疾病
CP	慢性非细菌性前列腺炎
CPPS	慢性骨盆疼痛综合征
CRF	慢性肾衰竭
CSS	变应性肉芽肿
DET	二乙基色胺
DIC	弥漫性血管内凝血
DKA	糖尿病酮症酸中毒
DLBCL	弥漫大 B 细胞性非霍奇金淋巴瘤
4-DMAP	4- 二甲基氨基苯酚
DMARDs	改变病情抗风湿药
DMHP·	（1，2 - 二甲基庚基)羟基四氢甲基二苯吡喃
DPD	二氢嘧啶脱氢酶
ED	勃起功能障碍
EGFR	表皮生长因子受体
EHF	流行性出血热
ELT	优球蛋白溶解时间
EM	（CYP2C19）快代谢型
EN	肠内营养
EST	内镜下括约肌切开术
ET	特发性震颤
FEV_1	第 1 秒用力呼气量
FKBPs	FK506 结合蛋白
G-6-PD	葡萄糖 -6- 磷酸脱氢酶
GABA/BZ	γ - 氨基丁酸 / 苯二氮䓬
GARFT	甘氨酸核糖核苷甲酰基转移酶
GBS	吉兰 - 巴雷综合征
GERD	胃食管反流病
GH	生长激素
GHB	γ - 羟丁酸
GIST	胃肠间质瘤
GVHD	移植物抗宿主反应
H_2RA	H_2 受体拮抗药
HAART	高活性的抗反转录病毒治疗
HACA	人抗嵌合抗体
HAMA	人抗鼠抗体
HBsAg	乙型肝炎病毒表面抗原
HCG	绒毛膜促性腺激素
HCT	血细胞比容
HCV	丙型肝炎病毒
HD	亨廷顿舞蹈病
HE	肝性脑病
HHS	高渗性高血糖状态
HIV	人类免疫缺陷病毒
HMG	尿促性素
HPA	下丘脑 - 垂体 - 肾上腺
HPRL	高催乳素血症
HPV	人类乳头瘤病毒
HRS	肝肾综合征
HT	激素替代
IBD	炎症性肠病
IBS	肠易激综合征
ICP	妊娠期肝内胆汁淤积症
ICS	吸入糖皮质激素
ICU	重症监护病房

IgE	抗免疫球蛋白 E
IHA	特发性醛固酮增多症
INN	国际非专利药名
INR	国际标准化比值
ITP	特发性血小板减少性紫癜
IVF-ET	体外受精 - 胚胎移植程序
LABA	长效 β_2 受体激动药
LN	狼疮性肾炎
LUTS	下尿路症状
MAC	最低肺泡有效浓度
MAOI	单胺氧化酶抑制药
MAP	轻型急性胰腺炎
MDMA	二亚甲基双氧安非他明
MDRSP	多药耐药的菌株
MDR-TB	耐多药结核病
MDS	骨髓增生异常综合征
MG	重症肌无力
MHC	主要组织相容性抗原复合物
MPA	显微镜下型多血管炎
MPAG	酚化葡萄糖苷糖
MRSA	耐甲氧西林金黄色葡萄球菌
MS	多发性硬化
MSSA	甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌
MUFA	单不饱和脂肪酸
NAB	夜间酸突破
NADH	烟酰胺腺嘌呤二核苷酸还原酶
NAPA	N- 乙酰卡尼
NB-UV	窄波紫外线
NCGS	坏死性新月体性肾炎
NIE	神经系统、免疫、内分泌
NK	自然杀伤细胞
NMDA	N- 甲基 -D- 天（门）冬氨酸
NPH	低精蛋白锌胰岛素
NPSLE	神经精神狼疮
NS	肾病综合征
NSAIDs	非甾体抗炎药
NSAIDs	非甾体抗炎药
NSSA	去甲肾上腺素能及特异性 5-HT 能抗抑郁药
NSTEMI	非 ST 段抬高心肌梗死
OA	骨性关节炎
OAB	膀胱过度活动症
$PaCO_2$	二氧化碳分压
PAH	肾上腺原发性增生
PaO_2	血氧分压
PBC	原发性胆汁性肝硬化
PCI	介入治疗
PD	帕金森病
PE	血浆当量单位
PEG	经皮内镜下胃造口
PICC	外周中心静脉置管
PM	慢代谢型
PPD	结核菌素
PPI	质子泵抑制药
PRL	正常催乳素
PsA	银屑病关节炎
PSP	酚磺酞排泄试验
PUVA	光化学疗法
PVC	聚氯乙烯塑料
RA	类风湿关节炎
RAAS	肾素 - 血管紧张素 - 醛固酮系统
RAU	复发性口腔溃疡
RCC	肾细胞癌
RPLS	可逆性后脑白质病综合征
RSV	呼吸道合胞病毒
RVVC	复发性假丝酵母菌病
SAP	重型急性胰腺炎
SARI	5-HT 受体拮抗药／再摄取抑制剂
SARS	严重急性呼吸综合征
SBP	自发性细菌性腹膜炎
SF	血清铁蛋白
SIADH	抗利尿激素分泌异常综合征
SLE	系统性红斑狼疮
SMON	亚急性视神经脊髓病
SNRI	5-HT 及去甲肾上腺素再摄取抑制剂
SSRIs	选择性 5- 羟色胺再摄取抑制药
SSSS	葡萄球菌烫伤样皮肤综合征
STEMI	ST 段抬高心肌梗死
$t_{1/2}$	半衰期
TAA	肿瘤相关抗原
TC	总胆固醇
TCI	靶控输注
TG	三酰甘油
TIA	短暂性脑缺血发作
TIL 细胞	肿瘤浸润淋巴细胞
TOD	靶器官损害
TP	胸腺嘧啶磷酸化酶
TPN	全胃肠外营养
TXA_2	血栓素 A_2
Ty21a	活伤寒疫苗
UA/NSTEMI	不稳定型心绞痛／非 ST 段抬高心肌梗死
UC	溃疡性结肠炎
UTI	泌尿、男性生殖系统感染
UVA	长波紫外线
UVB	中波紫外线
UVC	短波紫外线
VEGF	血管内皮生长因子
VVC	假丝酵母菌病
WG	韦格纳肉芽肿
WHO	世界卫生组织
XDR-TB	严重耐多药结核病

致　谢

勤牛辞岁，金虎迎春，在庚寅年庆贺之际，经过二百余位医药学专家两年多的努力，《中国国家处方集》2010版终于出版了。

《中国国家处方集》在我国尚属首部，无经验可循。为了贯彻落实《中华人民共和国药品管理法》和《处方管理办法》，办公室组织核心专家组通过学习、借鉴《世界卫生组织示范处方集》《英国国家处方集》等国内外权威著作，经过反复研究、探讨，结合中国国情、临床治疗习惯与疾病谱、地域分布、经济文化等因素制订了《中国国家处方集》总体构架、编写原则与内容、疾病分类原则、病种与药物遴选原则、编写须知、疾病与药物体例等，作为编写的依据。

为保证此书具有专业指导性，适应各级医疗机构临床使用，规范医护人员处方行为，各疾病治疗系统组的医药学专家从拟写初稿到出版进行了反复的审读、修改；核心专家组为了保证全书体例一致，不厌其烦地一对一、面对面地进行交流和讨论。各疾病治疗系统的组长基本是我国医药行业的著名专家、院士，他们不顾自身年迈及工作繁忙，对稿件进行反复研究、核对、修正。尤其2008年是不平凡的一年，我国经历了“汶川地震”“奥运会”“三聚氰胺毒牛奶”等一系列重大事件，各专家在百忙中抓紧点滴时间，加班加点认真细致地完成了全书的修改和审读等各项工作。

本书征求意见稿经过卫生部网站1个月的公示后，各治疗系统组长与核心专家组经过认真核查药品说明书、药品注册批件、药品专利说明书等材料，对社会各界反馈的近800条意见进行了反复讨论、复审，逐一进行修正。又将新颁布的《国家基本医疗保险、工伤保险和生育保险药品目录》中的280余个药品补充到了本书中，以使本书更加全面，体现了国家药物政策，满足了临床治疗的需要。

在此，向对本书给予关心支持的各位领导、医药界老前辈、老专家，以及为本书付出辛勤劳动的各位编委、编者和默默无闻的办公室工作人员，尤其是金有豫、毛节明、马明信、王汝龙、彭名炜、鲁云兰、杨蓓、张石革等核心专家组成员表示衷心的感谢！对人民军医出版社给予的大力支持与配合致以诚挚的谢意！

我们将通过“全国合理用药监测系统”对《中国国家处方集》的应用进行常态监测，依据循证医学、药物经济学等原理与方法进行分析评估，为再版《中国国家处方集》做好准备工作。

最后，再次向为本书付出辛勤劳动的各位领导、各位同仁表示衷心的感谢！

中 国 医 院 协 会

《中国国家处方集》办公室

二〇一〇年一月